(1) Veröffentlichungsnummer:

0 377 893

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 89123895.8

(1) Int. Cl.5: C07D 207/38, C07D 405/12, A01N 43/36

Anmeldetag: 23.12.89

Priorität: 07.01.89 DE 3900301 18.08.89 DE 3927222

43 Veröffentlichungstag der Anmeldung: 18.07.90 Patentblatt 90/29

Benannte Vertragsstaaten: BE CH DE ES FR GB IT LI NL

(7) Anmelder: BAYER AG

D-5090 Leverkusen 1 Bayerwerk(DE)

2 Erfinder: Fischer, Reiner, Dr. Nelly-Sachs-Strasse 23 D-4019 Monhelm(DE) Erfinder: Baasner, Bernd, Dr.

Wagner-Strasse 23

D-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE) Erfinder: Hagemann, Hermann, Dr.

Kandinsky-Strasse 52 D-5090 Leverkusen 1(DE) Erfinder: Krebs, Andreas, Dr.

Im Gartenfeld 70

D-5068 Odenthal-Holz(DE)

Erfinder: Marhold, Albrecht, Dr.

Carl-Duisberg-Strasse 329 D-5090 Leverkusen(DE)

Erfinder: Santel, Hans-Joachim, Dr.

Grünstrasse 9a

D-5090 Leverkusen(DE)

Erfinder: Schmidt, Robert R., Dr.

im Waldwinkel 110

D-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE)

Erfinder: Lürssen, Klaus, Dr. August-Kierspel-Strasse 145 D-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE) Erfinder: Becker, Benedikt, Dr.

Steinmannhof

1-39050 Pineta di Laives Bolzano(IT)

Erfinder: Schaller, Klaus, Dr. **Am Sonnenschein 38** D-5600 Wuppertal 1(DE) Erfinder: Strang, Harry, Dr.

Helderweg 53

D-4000 Düsseldorf 31(DE)

(9) 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate.

© Es werden neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I)

$$\begin{array}{c|c}
C & R-O & X \\
\hline
A-N & O
\end{array}$$

in welcher

für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht, Х

für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht.

für eine Zahl von 0-3 steht,

für Wasserstoff oder für die Gruppen -CO-R1, -CO-O-R2

steht

wobei R¹ und R² die im Anmeldungstext angegebene Bedeutung besitzen,

- A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Arylalkyl steht,
- B, C* unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Die neuen Verbindungen besitzen eine überraschende insektizide, akarizide, herbizide und antimykotische Wirksamkeit.

3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate

Die Erfindung betrifft neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Insektizide, Akarizide und Herbizide.

Von 3-Acyl-pyrrolidin-2,4-dionen sind pharmazeutische Eigenschaften vorbeschrieben (S. Suzuki et. al. Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967)). Weiterhin wurden N-Phenyl-pyrrolidin-2,4-dione von R. Schmierer und H. Mildenberger Liebigs Ann. Chem. 1985 1095 synthetisiert. Eine biologische Wirksamkeit dieser Verbindungen wurde nicht beschrieben.

In EP-A 0 262 399 werden ähnlich strukturierte Verbindungen (3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dione) offenbart, von denen jedoch keine herbizide, insektizide oder akarizide Wirkung bekannt geworden ist.

Es wurden nun neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate gefunden, die durch die Formel (I) dargestellt so sind,

$$\begin{array}{c|cccc}
 & C^* & R-O & X \\
\hline
 & A-N & O & X
\end{array}$$

in welcher

15

40

45

20 X für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

n f
ür eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff oder für die Gruppen -CO-R¹, -CO-O-R²

steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl und Cycloalkyl, das durch Heteroatome unterbrochen sein kann, gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Arylalkyl steht,

B und C* unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Im folgenden seien die folgenden Untergruppen definiert:

(la): Verbindungen der Formel (l) worin R = Wasserstoff,

(lb): Verbindungen der Formel (l) worin R = COR1,

(Ic): Verbindungen der Formel (I) worin R = COOR².

Weiterhin wurde gefunden, daß man 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dione bzw. deren Enole der Formel (la)

in welcher A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben, erhält, wenn man

(A)

N-Acylaminosäureester der Formel (II)

$$\begin{array}{c}
C^* CO_2 R^3 \\
A - N \\
0
\end{array}$$
(11)

in welcher

5

A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben

R3 für Alkyl steht,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert.

(B)

15 Außerdem wurde gefunden, daß man Verbindungen der Formel (Ib)

$$\begin{array}{c|c}
 & 0 \\
 & \parallel \\
 & R^{1}-C-O \\
 & X \\
 & X$$

25

20

in welcher A, B, C, X, Y, Z, R¹ und n die oben angegebene Bedeutung haben, erhält, wenn man Verbindungen der Formel (la),

30

35

in welcher

A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben,

a) mit Säurehalogeniden der allgemeinen Formel (III)

in welcher

R1 die oben angegebene Bedeutung hat

und

Hal für Halogen, insbesondere Chlor und Brom steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels,

oder

B) mit Carbonsäureanhydriden der allgemeinen Formel (IV)

R1-CO-O-CO-R1 (IV)

in welcher

R¹ die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels,

umsetzt.

(C)

Ferner wurde gefunden, daß man Verbindungen der Formel (Ic)

$$\begin{array}{c|c}
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\$$

10 in welcher

5

A, B, C*, X, Y, Z, R² und n die oben angegebene Bedeutung haben, erhält, wenn man Verbindungen der Formel (la)

20

35

15

in welcher

A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben, mit Chlorameisensäureester der allgemeinen Formel (V)

R2-O-CO-CI (V)

25 in welcher

R² die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfals in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

Überraschenderweise wurde gefunden, daß die neuen 3-Arylpyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) sich durch hervorragende insektizide, akarizide, herbizide und antimykotische Wirkungen auszeichnen.

Bevorzugt sind 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I), in welcher

X für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl steht,

Z für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

-CO-R1 (lb)

oder -CO-O-R² (Ic)

steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl und Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann, steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C_1 - C_6 -Alkyl-, C_1 - C_6 -Alkoxy-, C_1 - C_6 -Halogenalkyl-, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl;

für gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-, C₁-C₆-Halogenalkyl-, C₁-C₆-Halogenalkoxysubstituiertes Phenyl-C₁-C₆-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Phenoxy-C1-C6-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen, Amino und C₁-C₅-Alkyl-substituiertes Hetaryloxy-C₁-C₅-Alkyl steht,

R2 für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C₁-C₆-Alkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-, C₁-C₆-Halogenalkyl-substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl-C₁-C₆-Haloalkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxyalkyl steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I) in welcher

- 5 X für C₁-C₄-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy steht,
 - Y für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl steht,
 - Z für C₁-C₄-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy steht,
 - n für eine Zahl von 0-3 steht,
 - R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel
- 10 -CO-R1 (lb)

oder -CO-O-R2 (Ic)

steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl und Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl-C₁-C₄-alkyl steht,

20 für gegebenenfalls duch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,

gegebenenfalls für durch Halogen- und C1-C4-Alkyl-substituiertes Phenoxy-C1-C5-alkyl steht,

für gegebenfalls durch Halogen, Amino und C₁-C₄-Alkyl-substituiertes Hetaryloxy-C₁-C₅-alkyl steht,

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₁₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro-, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C_1 - C_1 0-Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl, C_3 - C_6 -Alkinyl, C_1 - C_8 -Alkoxy- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Polyalkoxy- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_8 -Alkylthio- C_2 - C_6 -alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatomen unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen-, C_1 - C_4 -Alkyl-, C_1 - C_4 -Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl- C_1 - C_4 -alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxyalkyl steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I) in welcher

- X für Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und Ethoxy steht,
- Y für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy und Trifluormethyl steht,
- Z für Methyl, Ethyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und Ethoxy steht,
- o n für eine Zahl von 0-3 steht,
 - R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

-CO-R1 (lb)

35

oder -CO-O-R2 (Ic)

steht, in welcher

45 R¹ für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes: C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Polyalkoxyl-C₂-C₄-alkyl und Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor, Brom-, Methyl-, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl-, Trifluormethoxy-, Nitro- substituiertes Phenyl steht,

50 für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluor-methyl, Trifluormethoxy-substituiertes Phenyl-C₁-C₃-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Pyridyl, Pyrimidyl, Thiazolyl und Pyrazolyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Phenoxy-C₁-C₄-alkyl steht,

55 für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Amino-, Methyl-, Ethyl-, substituiertes Pyridyloxy-C₁-C₄-alkyl, Pyrimidyloxy-C₁-C₄-alkyl und Thiazolyloxy-C₁-C₄-alkyl steht,

 R^2 für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1 - C_1 -Alkyl, C_2 - C_1 -Alkenyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_4 -Polyalkoxy- C_2 - C_6 -alkyl steht,

oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Nitro, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkinyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄- alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄- alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₄- alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatomen unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, iso-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluormethyl-, Nitro susbtituiertes Aryl-C₁-C₃-alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxyalkyl steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel I.

10

25

55

Verwendet man gemäß Verfahren (A) N-2,6-Dichlorphenylacetyl-N-methyl-alaninethylester, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

Verwendet man gemäß Verfahren (B) (Variante α) 3-(2,4,6-Trimethylphenyl)-1-isopropyl-pyrrolidin-2,4-dion und Pivaloylchlorid als Ausgangsstoff, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

Verwendet man gemäß Verfahren B (Variante ß) 3-(2,4,6-Trimethylphenyl)-1-cyclopentyl-pyrrolidin-2,4-dion und Acetanhydrid, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

H₃C-CO

$$CH_3$$
 H_3 C-CO

 CH_3
 H_3 C-CO

 CH_3
 CH_3

Verwendet man gemäß Verfahren C 3-(2,4-6-Trimethylphenyl)-1-methoxyethyl-5-methyl-pyrrolidin-2,4-dion und Chlorameisensäureethoxyethylester, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

10

5

Die bei dem obigen Verfahren (A) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (II)

15

20

in welcher

A, B, C*, X, Y, Z, n und R³ die oben angegebene Bedeutung haben sind teilweise bekannt oder lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden in einfacher Weise herstellen. So erhält man z.B. Acyl-aminosäureester der Formel (II), wenn man

a) Aminosäureester der Formel (VI),

30

35

in welcher

R⁴ für Wasserstoff (VIa) und Alkyl (VIb) steht

und

A, B und C* die oben angegebene Bedeutung haben mit Phenylessigsäurehalogeniden der Formel (VII)

(VII)

45

in welcher

X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben und für Chlor oder Brom steht, acyliert (Chem. Reviews 52 237-416 (1953); oder wenn man Acylaminosäuren der Formel (IIa),

$$A \xrightarrow{C^* CO_2 \mathbb{R}^4} X$$

$$0 \qquad Z_n \qquad (IIa)$$

5

55

10 in welcher A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben und R⁴ für Wasserstoff steht. verestert (Chem. Ind. (London) 1568 (1968)). 15 Beispielhaft seien folgende Verbindungen der Formel (II) genannt: N-Isopropyl-N-(2,4-Dichlorphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 2. N-Isopropyl-N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 3. N-(2.6-Dichlorphenyl-acetyl)-sarkosin-methylester 4. N-Isopropyl-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 20 5. N-Methoxyethyl-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 6. N-Methoxyethyl-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 7. N-tert.-Butyl-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 8. N-Methyl-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 9. N-2-(2,4,4-trimethyl-pentyl)-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 25 10. N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-sarkosin-methylester 11. N-Ethyl-N-(2.4.6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 12. N-Isopropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 13. N-tert.-Butyl-N-(2.4.6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 14. N-iso-Butyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 30 15. N-sec-Butyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 16. N-neo-Pentyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 17. N-2-(2,3-Dimethyl-butyl)-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 18. N-2-(2,2,3-Trimethyl-butyl)-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 19. N-Cyclopropyl-N-(2.4.6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 35 20. N-Cyclopentyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 21. N-Cyclohexyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 22. N-Alkyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 23. N-Benzyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 24. N-2-(2.4.4-trimethyl-pentyl)-N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 40 25. N-Methoxyethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 26. N-Methoxypropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 27. N-Methoxy-2-methyl-propyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 28. N-2-(Ethoxy-butyl)-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 29. N-2-(Methoxy-propyl)-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 45 30. N-Ethyl-mercaptoethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 31. N-Methyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 32. N-Ethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 33. N-Isopropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 34. N-Isobutyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 50 35. N-sec-Butyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 36. N-Cyclopropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 37. N-Cyclopentyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 38. N-Cyclohexyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 39. N-Methoxyethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester

N-Methoxypropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester
 N-Methyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-buttersäure-ethylester
 N-Ethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-buttersäure-ethylester
 N-Methyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-valeriansäure-ethylester

- 44. N-Methyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-iso-valeriansäure-ethylester
- 45. N-Ethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-valeriansäure-ethylester
- 46. N-Ethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-iso-valeriansäure-ethylester
- 47. N-Methyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-methylalanin-ethylester
- 48. N-Ethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-methylalanin-ethylester
- 49. N-Isopropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-methylalanin-ethylester

Beispielhaft sind folgende Verbindungen der Formel (IIa) genannt:

1. N-(2,4-Dichlorphenyl-acetyl)-sarkosin

5

10

45

- 2. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-sarkosin
- 3. N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-sarkosin

Verbindungen der Formel (IIa) sind beispielsweise aus den Phenylessigsäurehalogeniden der Formel (VII) und Aminosäuren der Formel (VIa) nach Schotten-Baumann (Organikum 9, Auflage 446 (1970) VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin) erhältlich.

Verbindungen der Formel VI, in welchen A, B, C und R⁴ die oben angegebene Bedeutung haben, sind nach literaturbekannten Verfahren aus α-Halogencarbonsäuren bzw. -estern und Aminen erhältlich (Advanced Organic Chemistry, J. March S. 377, Mc Graw-Hill Inc. 1977).

Das Verfahren (A) ist dadurch gekennzeichnet, daß Verbindungen der Formel (II) in welcher A, B, C, X, Y, Z, m, n und R³ die oben angegebene Bedeutung haben in Gegenwart von Basen einer intramolekularen Kondensation unterwirft.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (A) alle üblichen inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Toluol und Xylol, ferner Ether, wie Dibutylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Glylkoldimethylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare Lösungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Dimethylformamid und N-Methylpyrrolidon.

Als Deprotonierungsmittel können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) alle üblichen Protonenakzeptoren eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Alkalimetall- und Erdalkalimetall-oxide, -hydroxide und -carbonate, wie Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Magnesiumoxid, Calciumoxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat, die auch in Gegenwart von Phasentransferkatalysatoren wie z.B. Triethylbenzylammoniumchlorid, Tetrabutylammoniumbromid, Adogen 464 oder TDA 1 eingesetzt werden können. Ferner sind Alkalimetall- und Erdalkalimetallamide und -hydride, wie Natriumamid, Natriumhydrid und Calciumhydrid, und außerdem auch Alkalimetall-alkoholate, wie Natriummethylat und Kalium-tert.-butylat einsetzbar.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 250°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 150°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (A) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

Adogen 464 = Methyltrialkyl(C₈-C₁₀)ammoniumchlorid

TDA 1 = Tris-(methoxyethoxylethyl)-amin

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) setzt man die Reaktionskomponenten der Formeln (II) und die deprotonierenden Basen im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis zu 3 Mol) zu verwenden.

Das Verfahren (Ba) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (Ia) mit Carbonsäurehalogeniden der Formel (III) umsetzt.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (Ba) bei Verwendung der Säurehalogenide alle gegenüber diesen Verbindungen inerten Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol und Tetralin, ferner Halogenkohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, außerdem Ketone, wie Aceton und Methylisopropylketon, weiterhin Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, darüberhinaus Carbonsäureester, wie Ethylacetat, und auch stark polare Solventien, wie Dimethylsulfoxid und Sulfolan. Wenn die Hydrolysestabilität des Säurehalogenids es zuläßt, kann die Umsetzung auch in Gegenwart von Wasser durchgeführt werden.

Verwendet man die entsprechenden Carbonsäurehalogenide so kommen als Säurebindemittel bei der Umsetzung nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (Ba) alle üblichen Säureakzeptoren in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicycloundecen (DBU), Diazabicyclononben (DBN), Hünig-Base und N,N-Dimethyl-anilin, ferner Erdalkalimetalloxide, wie Magnesium- und Calciumoxid, außerdem Alkali- und Erdalkali-metall-carbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (Bα) auch bei der Verwendung von Carbonsäurehalogeniden innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens ($B\alpha$) werden die Ausgangsstoffe der Formel (Ia) und das Carbonsäurehalogenid der Formel (III) im allgemeinen in angenähert äquivalenten Mengen verwendet.

Es ist jedoch auch möglich, das Carbonsäureanhydrid in einem größeren Überschuß (bis zu 5 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Das Verfahren (Bß) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (la) mit Carbonsäurehydriden der Formel (IV) umsetzt.

Verwendet man bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (Bß) als Reaktionskomponente der Formel (IV) Carbonsäureanhydride, so können als Verdünnungsmittel vorzugsweise diejenigen Verdünnungsmittel verwendet werden, die auch bei der Verwendung von Säurehalogeniden vorzugsweise in Betracht kommen. Im übrigen kann auch ein im Überschuß eingesetztes Carbonsäurehydrid gleichzeitig als Verdünnungsmittel fungieren.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (Bß) auch bei der Verwendung von Carbonsäureanhydriden innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die Ausgangsstoffe der Formel (Ia) und das Carbonsäureanhydrid der Formel (IV) im allgemeinen in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, das Carbonsäureanhydrid in einem größeren Überschuß (bis zu 5 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Im allgemeinen geht man so vor, daß man Verdünnungsmittel und im Überschuß vorhandenes Carbonsäureanhydrid sowie die entstehende Carbonsäure durch Destillation oder durch Waschen mit einem organischen Lösungsmittel oder mit Wasser entfernt.

Das Verfahren (C) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (la) mit Chlorameisensäureestern der Formel (V) umsetzt.

Verwendet man die entsprechenden Chlorameisensäureester so kommen als Säurebindemittel bei der Umsetzung nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (C) alle üblichen Säureakzeptoren in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, DABCO, DBC, DBA, Hünig-Base und N,N-Dimethyl-anilin, ferner Erdalkalimetalloxide, wie Magnesium- und Calcium-oxid, außerdem Alkali- und Erdalkali-metall-carbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (C) bei Verwendung der Chlorameisensäureester alle gegenüber diesen Verbindungen inerten Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol und Tetralin, ferner Halogenkohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenwasserstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, außerdem Ketone, wie Aceton und Methylisopropylketon, weiterhin Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, darüberhinaus Carbonsäureester, wie Ethylacetat, und auch stark polare Solventien, wie Dimethylsulfoxid und Sulfolan.

Bei Verwendung der Chlorameisensäureester als Carbonsäure-Derivate der Formel (V) können die Reaktionstemperaturen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Arbeitet man in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und eines Säurebindemittels, so liegen die Reaktionstemperaturen im allgemeinen zwischen -20°C und +100°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 50°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (C) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) werden die Ausgangsstoffe der Formel (Ia) und der entsprechende (Chlorameisensäureester der Formel (V) im allgemeinen in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis zu 2 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt dann nach üblichen Methoden. Im allgemeinen geht man so vor, daß man ausgefallene Salze entfernt und das verbleibende Reaktionsgemisch durch Abziehen des Verdünnungsmittels einengt.

55

10

25

30

Beispiel 1:

3,9 g (0,13 Mol) Natriumhydrid (80%ig) werden in 70 ml abs. Toluol vorgelegt. Nach Zutropfen von 36,2 g (0,107 Mol) N-2,6-Dichlorphenylacetyl-N-isopropyl-glycinethylester in 160 ml abs. Toluol, erhitzt man 6 h unter Rückfluß. Unter Eisbadkühlung werden 20 ml Ethanol zugetropft, der Ansatz im Vakuum einrotiert, der Rückstand in 1 N NaOH gelöst und das 3-(2,6-Dichlorphenyl)-1-isopropyl-pyrrolidin-2,4-dion bei 0-20° C mit konzentrierter Salzsäure gefällt. Das Produkt wird zur Reinigung mit Chloroform ausgekocht, anschließend wird n-Hexan zugesetzt und das ausgefallene, farblose Produkt abgesaugt.

Ausbeute: 25,42 g (83 % d. Theorie) Fp. >230° C.

Beispiel 2:

5

10

25

30

3,42 g (15 mmol) 3-(2,4,6-Trimethylphenyl)-1-methyl-pyrrolidin-2,4-dion werden in 50 ml abs. Tetrahydrofuran (THF) suspendiert und mit 1,22 ml (15 mmol) abs. Pyridin und 2,54 ml (15 mmol) Ethyldiisopropylamin versetzt. Dazu tropft man bei 0°-10°C 1,88 ml (15 mmol) Pivaloylchlorid gelöst in 5 ml abs. THF und rührt 30 Min. nach. Der Niederschlag wird abfiltriert, die Lösung im Vakuum einrotiert und der Rückstand an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigester 1:1 chromatographiert.

Durch Kristallisation aus Ether/n-Hexan erhält man 3,8 g (80,4% der Theorie) 4-(Pivaloyloxy)-3-(2,4,6-trimethylphenyl)-1-methyl-3-pyrrolin-2-on von Schmp. 75°C.

Beispiel 3

5,18 g (20 mmol) 3-(2,4,6-trimethylphenyl)-1-isopropyl-pyrrolidin-2,4-dion werden in 70 ml tert.-Butylme-

thylether (MTB-Ether) suspendiert. Nach Zugabe von 1,63 ml (20 mmol) abs, Pyridin und 3,4 ml (20 mmol) Ethyl-diisopropylamin tropft man bei 0 °C - 10 °C 2,45 g (20 mmol) Chlorameisensäure-isopropylester, gelöst in 5 ml MTB-Ether, zu, rührt 30 Minuten nach, filtriert ab und rotiert ein. Der Rückstand wird an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigester 1 : 1 chromatographiert. Durch Kristallisation aus n-Hexan erhält man 4,67 g (67,6% der Theorie) 4-Isopropoxy-carbonyloxy-3-(2,4,6-trimethylphenyl)-1-isopropyl-3-pyrrolin-2-on vom Schmelzpunkt 81 °C.

In entsprechender Weise zu den Herstellungsbeispielen und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man die in den nachfolgenden Tabellen 1-3 formelgmäßig aufgeführten 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion(e)-Derivate der Formel (la) - (lc).

Tabelle 1

5

10	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	Fp °C
	4	Cl	Cl	Н	(СН ₃) ₂ СН-	Н	Н	198
15	5	C1	н	6-C1	CH3-	н	Н	230
	6	Cl	н	6-C1	сн3-	сн3-	H	221
22	7	Cl	н	6-C1	(сн ₃) ₂ сн-	CH3-	сн3-	180
20	8	Cl	Н.	6-C1	(CH3)3C-	н	н	> 230
	9	Cl	н	6-C1	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -	н	н) 235
25	10	Cl	н	6-C1	(CH ₃ O-(CH ₂) ₂ -	н	н	> 230
	11	Cl	Н	6-C1	CH3-0-(CH2)2-	н	н	128
	12	сн3	сн3	6-CH3	сн3-	н	н	> 230
30	13	CH3	CH3	6-CH3	сн ₃ -	сн ₃ -	н) 230
	14	CH3	сн3	6-CH ³	сн ₃ -	C ₂ H ₅	н	210
35	15	CH3	сн ³	6-CH3	сн3-	С ₃ Н ₇	н	
	16	CH ³	CH3	6-CH3	сн3-	(CH ₃) ₂ CH-	н	٠
	17	CH ³	сн3	6-CH ₃	сн3-	СН ^З -	СН3-	
40	18	CH3	CH ³	6-CH3	с ₂ н ₅	н	н) 230
	19	CH3	CH3	6-CH3	C2H5	сн ₃ -	H	227
45	20	CH3	CH ³	6-CH ³	c ₂ H ₅	с ₂ н ₅ -	н	184
	21	CH3	CH ³	6-CH ³	c _{2H2}	C3H7-	H	
	22	CH3	CH3	6-CH ³	C ₂ H ₅	(CH3)SCH-	H	
50	23	СНЗ	CH3	6-CH3	c ₂ H ₅	сн3-	сн3-	

<u>Tabelle 1</u> (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	X	Y	z _n	λ	В	C*	Fp °C
24	сн3	снз	6-CH ³	с ₃ н ₇	н	н	
25	снз	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇	сн3-	H	
· 26	СНЗ	СНЗ	6-CH3	С ₃ Н ₇	C2H5-	H	
27	снз	СНЗ	6-CH3	C3H7	C3H7	H	
28	снз	снз	6-CH ₃	С ₃ н ₇	(CH ₃) ₂ CH-	H	
29	снз	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇	сн ³ -	сн3-	
30	снз	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	H	H	> 220
31	сн3	СНЗ	6-CH3	(сн ₃)2сн-	сн3-	H	228
32	снз	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	C ₂ H ₅	H	
33	СН ³	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	C3H7	н .	
34	СНЭ	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	(CH ₃) ₂ CH-	Н	
35	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	сн ³ -	сн3-	
36	снз	снз	6-CH ₃	C ₄ H ₉ .	н	н	
37	СНЗ	СНЗ	6-CH ₃	C4H9	сн ₃ -	н	
38	CH3	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	. Н	н	209
39	CH3	СНЗ	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	сн ₃ -	н	189
40	снз	CH3	6-CH3	С2 ^Н 5 СН-	н	н	2 62
41	сн3	сн3	6-CH3	CH-	сн3-	н	205

<u>Tabelle 1</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z'n	, A	В	C*	Fp °C
10	42	CH ³	CH ³	•	(CH ₃) ₃ C-	Н	Н	> 230
	43	CH3	CH3	6-CH3	(CH3)3C-CH2-	H	н	> 230
	44	CH3	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-	н	н	> 230
15	45	снз	CH3	6-CH3	(сн ₃)3с-сн(сн3)-	н	н	> 230
	46	сн3	сн ³	6-CH3	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -	н	н	> 230
	47	сн3 -	CH3	6-CH3	CH ₂ =CH-CH ₂ -	н	н	212
20	48 -	CH3	сн3	6-CH3	CH ₂ =CH-CH ₂ -	сн3-	н	
	49	сн3	сн3	6-CH3	>	Ĥ	н	> 230
25	50	сн3	сн3	6-CH3	>	сн3-	н	> 230
	51 -	сн3	сн3	6-CH3	>	C2H5-	н	
	52	сн3	сн3	6-CH3	>	с ₃ н ₇ -	н	
30	53	сн3	сн3	6-CH3	>	(CH3) SCH-	н	
•	54	сн3	сн3	6-CH3	> .	с н ₃ -	сн3-	
35 .	55	сн3	сн3	6-СН _З	<u> </u>	н	н	> 230
40	56	сн3	сн3	6-CH3	\Box	сн3-	H .	223
45	57	снз	снз	6-CH3	\Box	с ₂ н ₅ -	н	
	58	снз	CH3	6-CH3	\Box	С ₃ н ₇ -	н	

55

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 1</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C* Fp ° C
10	59	CH3	CH3	6-CH3	\Box	(сн ₃)2сн-	н
. 15	60	CH3	СНЗ	6-CH ₃		сн3-	сн3-
	61	CH3	снз	6-CH3	<u></u>	н	н) 230
20	62	снз	CH3	6-CH3	<u></u>	сн3-	н) 230
25	63	сн3	снз	6-CH ₃	<u></u>	с ₂ н ₅ -	н
30	64 _.	сн3	сн3	6-CH3	\bigcirc	C ₃ H ₇ -	н
	65	снз	сн3	6-CH ₃	\bigcirc	(CH ₃) ₂ CH-	н
35	66	снз	сн3	6-СН3	\bigcirc	сн3-	СН3-
40	67	снз	СН3	6-CH3		н	H > 230
45	68	СНЗ	СНЗ	6-CH3		СН3-	н

50

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 1</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	Z _n	λ	В	C*	Fp °C
	69	сн3	Сн3	6-СН _З	сн ₃ -о-(сн ₂) ₂ -	н	н	179
10	70	CH ³	CH ³	6-CH3	CH3-0-(CH2)2-	сн3-	н	165
	71	CH ³	СН3	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)-	Н	н	220
_	72	сн3	сн3	6-сн ₃	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)-	СН3-	н-	
15	73	снз	сн3	6-CH3	CH3-0-(CH2)3-	H	н	190
	74	снз	сн3	6-CH3	CH3-0-(CH2)3-	сн3-	н	175
20	75	сн3	СН3	6-CH3	с245-0-(СН2)2-СН(СН3)-	н	Н	220
	76	сн ³	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -о-(сн ₂) ₂ -сн(сн ₃)-	сн3-	н	
	77	снз	CH3	6-CH ₃	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)-сн ₂ -	н	н	156
25	78	снз	CH3	6-CH3	C2H5-S-(CH2)2-	н	Н	165

Tabelle 2

 $\begin{array}{c|c}
R^{1}-C-O & X \\
\hline
R^{2} & & \\
\hline
C^{*} & & \\
\hline
A-N & & \\
\end{array}$ (1b)

	Bsp. Nr.	x	Y	ż _n	A	В	C*	R ¹	Fp °C
15									
	79	C1	C1	н	(CH3)2CH-	н	Н	сн ³ -	128
	80	C1	н	6-C1	CH3-	CH3-	H	сн ³ -	125
20	81	Cl	Н	6-C1	СН3-	CH3-	H	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
	82	Cl	н	6-C1	сн3-	CH3-	н	(CH3)3C-	68
25	83	Cl	н	6-C1	(сн ³) ⁵ сн-	н	H	сн ₃ -	113
	84	Cl	н	6-C1	(сн ³) ⁵ сн-	H	н	(сн ₃) ₂ сн-	105
	85	C1	н	6-C1	(сн ₃) ₂ сн-	н	H	(сн ₃)3с-	122
30	86	Cl	н	6-C1	(сн ₃)2сн-	н	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	112
	87	Cl	н	6-C1	(CH3)3C-	н	н	СН3-	113
35	88	Cl	н	6-C1	(CH3)3C-	Н	н	. (сн ₃) ₂ сн-	117
	89	C1	н	6-C1	(сн ³) ³ с-	Н	н	(сн ₃)3с-	158
	90	CH3	СНЗ	6-CH3	CH3-	H	H	СН ₃ -	Öl
40	91	CH3	сн3	6-CH ³	СН3-	H	Н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
	92	CH ³	сн3	6-CH3	сн3-	H	H	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	45
45	93	снз	сн3	6-CH3	сн3-	сн3-	H	сн ₃ -	75
·•	94	CH3	сн3	6-CH3	сн3-	сн3-	H	(CH ₃) ₂ CH-	Öı
	95	CH3	сн3	6-CH3	сн3-	сн3-	н	(сн ₃)3с-	Öl

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	96	СНЗ	сн3	6-CH3	сн3-	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	
	97	СНЗ	CH ³	6-CH3	сн3-	сн3-	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	Öl
	98	СНЗ	CH3	6-CH ₃	CH3-	сн3-	н	сн30-сн5-с(сн3)5-	Öl
15	99	сн3	CH3	6-CH3	сн3-	сн3-	н	C1CH2-C(CH3)2-	Öl
20	100	сн3	сн3	6-CH3	сн3-	сн ₃ -	н	сн ³ 0 сн ³	
	101	CH3	CH3	6-CH3	сн3-	сн ₃ -	н	(СН ₃) ₂ С=СН-	
25	102	сн3	CH3	6-CH3	сн3-	сн ₃ -	н	0 <ch3< td=""><td></td></ch3<>	
	103	CH3	CH3	6-CH3	сн3-	C2H5-	Н	сн3-	
30	104	CH3	CH3	6-CH3	сн3-	с ₂ н ₅ -	Н	(сн ₃) ₂ сн-	
	105	CH ³	CH ³	6-CH3	сн3-	с ₂ н ₅ -	Н	(сн ₃) ₃ с-	
	106	CH ³	CH ³	6-CH3	сн3-	C2H5-	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	
35	107	CH3	CH3	6-CH ³	сн3-	C2H5-	H	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	108	CH3	CH3	6-CH ³	сн3-	C ₂ H ₅ -	н	сн ₃ 0-сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -	•
40	109	CH3	CH3	6-CH3	сн3-	C ₂ H ₅ -	н	C1CH2-C(CH3)2-	
	110	сн3	СНЗ	6-CH3	сн3-	с ₂ н ₅ -	н	сн ₃ о сн ₃	
45	111	CH3	CH3	6-CH3	CH3-	C ₂ H ₅ -	H	(CH ₃) ₂ C=CH-	
50	112	СНЗ	снз	6-CH ₃	CH3-	с ₂ н ₅ .	н	CH3	

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
10	113	сн3	сн3	6-CH ₃	СН3-	C ₃ H ₇ -	н	сн3-	
	114	сн3	сн3	6-CH3	сн3-	C3H7-	н	(сн ₃) ₂ сн-	
	115	сн3	CH3	6-CH3	сн3-	C3H7-	н	(сн ₃) ₃ с-	
15	116	снз	сн3	6-CH3	сн3-	с ₃ н ₇ -	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	
	117	снз	снз	6-CH3	сн3-	(CH3)2CH-	н	сн ₃ -	
20	118	снз	снз	6-CH3	сн3-	(CH ₃) ₂ CH-	н	(СН ₃) ₂ СН-	
	119	снз	снз	6-CH3	сн3-	(CH3)2CH-	н	(CH3)3C-	
	120	сн3	снз	6-CH3	сн3-	(сн ₃) ₂ сн-	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	
25	121	снз	снз	6-CH3	сн3-	сн3-	сн3-	сн3-	
	122	сн3	сн3	6-CH3	сн3-	сн3-	сн3-	(сн ₃) ₂ сн-	
30	123	сн3	сн3	6-CH3	сн3-	сн3-	сн3-	(сн ₃)3с-	-
	124	снз	сн3	6-CH3	сн3-	сн3-	сн3-	(CH ₃) ₂ -CH-C(CH ₃) ₂ -	
	125	сн3	сн3	6-CH ³	С ₂ Н ₅	н	н	сн ₃ -	85
35	126	CH ³	сн3	6-CH3	C ₂ H ₅	н	н	(CH3)2CH-	
	127	снз	снЗ	6-CH3	с ₂ н ₅	н	н	(СН ₃)3С-	99
40	128	CH3	Ċн ^З	6-CH3	с ₂ н ₅	н	н	(CH ₃) ₂ -CH-C(CH ₃) ₂ -	
	129	CH3	CH3	6-CH3	C ₂ H ₅	H	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	130	CH3	CH3	6-CH3	C2H5	н	H	сн ₃ 0-сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -	
45	131	сн3	CH ³	6-CH3	C2H5	H	H	стен2-с(сн3)5-	
50	132	CH3	снз	6-сн3	С ₂ Н ₅	н	н	сн ₃ о сн ₃	

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C.
. 10	133	сн3	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	н	н	(CH3) ² C=CH-	
	134	сн3	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	н	н	° CH3	
15	135	СНЗ	СНЗ	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	CH3-	н	сн3-	Öl
	136	сн3	снз	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	CH3-	н	(сн ₃) ₂ сн-	
	137	сн3	CH3	6-CH3	C ₂ H ₅ -	сн ₃ -	Н	(CH ₃) ₃ C-	Öl
20	138	СНЗ	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	сн3-	н	(сн ₃) ₂ -сн-с(сн	3 ⁾ 2 ⁻
	139	сн3	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	СН ₃ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	Öl
25	140	снз	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	СH3-	Н	сн ₃ 0-сн ₂ -с(сн ₃)2-
	141	сн3	сн3	6-CH3	C ₂ H ₅ -	CH3-	Н	C1CH2-C(CH3)2-	
30	142	CH ³	снз	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	сн3-	н	сн ₃ о сн ₃	I
	143	CH3	снз	6-CH3	C ₂ H ₅ -	СН3-	н	(сн3)2с=сн-	
35	144	снз	снз	6-СН _З	с ₂ н ₅ -	сн ₃ -	н	<0 → CH ³	
	145	СНЗ	СНЗ	6-CH ³	C ₂ H ₅ -	C2H5-	H	сн3-	
40	146	CH3	CH3	6-CH3	C2H5-	C2H5-	H	(CH3) 2CH-	
	147	CH3	CH3	6-CH3	C ₂ H ₅ -	C2H5-	н	(CH3)3C-	
45	148	CH3	CH3	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	C2H5-	н	(CH3)2-CH-C(CH	¹ 3 ⁾ 2 ⁻
45	149	CH3	снз	6-CH3	C2H5-	C ₂ H ₅ -	н	(сн ₃)3с-сн ₂ -	

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp.	x	Y	Z _n	λ	В .	C*	R ¹	Fp °C
10	150	сн3	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	c ₂ H ₅ -	н	сн ₃ о-сн ₂ -с(с	H ₃) ₂ -
	151	CH3	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	c ₂ H ₅ -	H	с1сн2-с(сн3)	2-
15	152	снз	сн3	6-сн3	с ₂ н ₅ -	с ₂ н ₅ -	H	сн ₃ о сн ₃)
	153	снз	CH ³	6-CH3	с ₂ н ₅ -	С ₂ Н ₅ -	н	(CH3)2C=CH-	
20	154	CH3	СН3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	с ₂ н ₅ -	H	(CH3	
	155	CH3	CH ³	6-CH3	с ₂ н ₅ -	С ₃ н ₇ -	н	сн3-	
25	156	сн3	СНЗ	6-CH3	C ₂ H ₅ -	С ₃ Н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
	157	сн3	CH ³	6-CH3	C2H5-	С ₃ Н ₇ -	H	(CH3)3C-	
30	158	СНЗ	CH ³	6-CH ³	с ₂ н ₅ -	C3H7-	н	(CH3)2CH-C(CH ₃) ₂ -
	159	CH3	СНЗ	6-CH3	C2H2-	(сн ₃) ₂ сн-	H	СН3-	
	160	CH3	сн3	6-CH3	C2H5-	(CH ₃) ₂ CH-	H	(CH ₃) ₂ CH-	
35	161	CH ³	сн3	6-CH3	c ₂ H ₅ -	(CH ₃) ₂ CH-	н	(CH3)3C-	
	162	CH ³	CH ³	6-CH ³	с ₂ н ₅ -	(CH3)2CH-	H	(CH ₃) ₂ CH-C((CH ₃) ₂ -
40	163	CH3	CH3	6-CH3	C2H5-	СH ³ -	сн3-	CH3-	
	164	CH3	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	сн3-	сн3-	(CH3)2CH-	
	165	CH ³	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	СН3-	сн3-	(CH3)3C-	
45	166	СНЗ	CH3	6-CH3	C2H5-	CH3	СН3-	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -
	167	CH3	сн3	6-CH3	C3H7	н	H	СН3-	

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	\mathbb{R}^1	Fp °C
10	168	CH3	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	н	(сн ₃)2сн-	
	169	CH3	сн3	6-CH3	C3H7-	• н	H	(CH3)3C-	
	170	CH ³	сн3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	н	H	(CH ₃)2-CH-C	CH ₃) ₂ -
15	171	CH3	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	· -
	172	CH3	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	н	сн ₃ о-сн ₂ -с (с	
20	173	CH3	сн3	6-CH ³	С ₃ Н ₇ -	н	Н	C1CH2-C(CH3)	2-
20	174	сн3	сн3	6-CH ³	С ₃ Н ₇ -	н	н	сн ³ 0	Н3
25	175	сн3	CH3	6-CH3	C3H7-	н	н	(сн ₃) ₂ с=сн-	
	176	СНЗ	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	н	ОСH ³	
30	177	CH3	CH ³	6-CH3	с ₃ н ₇ -	сн3-	н	сн ₃ -	
	178	CH3	CH ³	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	СН3-	н	(CH3) 2CH-	
35	179	CH3	снз	6-CH3	C3H7-	сн3-	н	(CH ₃) ₃ C-	
	180	CH3	сн3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	сн ₃ -	H	(CH ₃) ₂ -CH-C(CH ₃) ₂ -
	181	CH3	CH3	6-CH3	C3H7-	СН3-	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
40	182	CH3	СНЗ	6-CH3	С ₃ н ₇ -	сн3-	н	сн ₃ 0-сн ₂ -с(с	H ₃) ₂ -
	183	CH3	СНЗ	6-CH3	C3H7-	сн3-	н	C1CH2-C(CH3)	2-
45	184	снз	сн3	6-СН3	С ₃ н ₇ -	сн3-	н	CH30 C	н _З

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Υ .	z _n	λ	В	C *	R ¹	Fp °C
10	185	Сн3	CH ³	6-CH ₃	с ₃ н ₇ -	сн3-	н	(сн ₃) ₂ с=сн-	
	. 186	СНЗ	CH ³	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	СН3-	н	0CH ³	
15	187	CH3	CH3	6-СН3	с ₃ н ₇ -	C ₂ H ₅ -	н	CH3-	
	188	сн3	снз	6-CH3	С ₃ н ₇ -	С ₂ н ₅ -	н	(CH ₃) ₂ CH-	
20	189	сн3	снз	6-CH3	С ₃ н ₇ -	с ₂ н ₅ -	Н	(CH3)3C-	
20	190	сн3	сн3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃)2-сн-с (сн ₃) ₂ -
	191	сн3	снз	6-CH3	С ₃ н ₇ -	C2H5-	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
25	192	CH3	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	C2H5-	н	сн ₃ 0-сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -
	193	CH ³	CH ³	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	с ₂ н ₅ -	Н	C1CH2-C(CH3)2	-
30	194	снз	сн3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	C ₂ H ₅ -	н	сн ₃ о сн	 3
	195	снз	снз	6-CH ³	C3H7-	с ₂ н ₅ -	H	(CH ₃) ₂ C=CH-	
35	196	снз	снз	6-CH3	с ₃ н ₇ -	с ₂ н ₅ -	н	0CH ³	
	197	CH3	снз	6-CH ₃	C3H7-	C3H7-	н	сн ₃ -	
40	198	CH3	снз	6-CH3	C3H7-	С ₃ Н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
	199	СНЗ	СНЗ	6-CH3	C3H7-	С ₃ н ₇ -	H	(CH3)3C-	
45	200	снз	снз	6-CH3	С ₃ н ₇ -	С ₃ Н ₇	н	(CH3)2CH-C(CH3)2-
	201	снз	CH3	6-CH3	C3H7-	(CH ₃) ₂ CH-	н	сн3-	
	202	СНЗ	CH3	6-CH3	C3H7-	(CH ₃) ₂ CH-	. Н	(сн3)2сн-	· .

55

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	A	В	C*	R ¹	Fp °C
									
10	203	CH ³	CH ³	6-CH3	С ₃ Н ₇ - (С	н ₃)2сн-	H	(CH3)3C-	
	204	CH3	CH ³	6-CH ₃	С ₃ Н ₇ - (С	H3)2CH-	H	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃) ₂ -	
	205	сн3	CH3	6-CH3	C3H7-	сн3-	СН3-	сн ₃ -	
15	206	снз	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	сн3-	СН3-	(СН ₃) ₂ СН-	
	207	сн3	сн3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	сн3-	CH3-	(CH ₃) ₃ C-	
	208	CH3	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	СН3-	СН3-	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂	-
20	209	сн3	сн ₃	6-CH3	(сн ₃)2сн-	н	н	сн ₃ -	75
	210	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	н	(сн ₃) ₂ сн-	08
25	211	снз	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	H	Н	(CH ₃) ₃ C-	86
	212	CH3	сн3	6-CH3	(CH3)2CH-	H	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	108
	213	СНЗ	CH ³	6-CH3	(CH3)2CH-	н	н	(CH3)3C-CH2-	74
30	214	сн ³	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	H	н	СН ₃ 0-СН ₂ -С(СН ₃) ₂ -	68
	215	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	н	C1CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -	153
				_				сн30✓	
35	216	CH3	снз	6-CH3	(сн3) 5сн-	н	Н	сн _з о сн _з	
	217	CH3	СНЗ	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-	н	н	(CH ₃) ₂ C=CH-	67
40		J	3	J	3.2			0	0.
	218	CH3	CH3	6-CH3	(CH3) ^S CH-	Н	H	\\X3	
								,NO ₂	
45	219	СНЗ	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	н.		
		3	3	3	3. 2	••	••	\ /	

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	220	снз	сн ₃	. 6-СН _З	(сн3) ² сн-	н	н	NO ₂	
15	221	сн3	СНЗ	6-CH3	(СН ₃) ₂ СН-	н	H	02N-	
20	222	сн3	сн ₃	6-СН ^З	(сн ₃) ₂ сн-	н	H	C1	
25	223	сн ₃	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	Н	н	C1	
30 .	224	СНЗ	CH3	6-CH ₃	(CH ₃)2CH-	н	н	c1—	•
35	225	снз	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	н	н	CH3	
	226	снз	CH3	6-CH3	(сн ₃)2сн-	н	H	CH3	
40	227	снз	снз	6-СН ³	(сн ₃) ₂ сн-	н	н	сн3—	
45	228	сн3	сн3	6-СН _З	(сн ₃) ₂ сн-	н	н	OCH3	

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
229	снз	снз	6-CH ₃	(сн3) 2сн-	H	н	H ₃ CO	
230	CH3	сн3	6-СН3	(сн ₃) ₂ сн-	н	н	н ₃ со-С	
231	снз	CH ³	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	снз	н	CH3-	Öl
232	CH3	CH ³	6-CH3	(CH3)2CH-	снз	H	(сн ₃) ₂ сн-	
233	СH ³	снз	6-CH3	(сн3) 5сн-	сн3	Н	(сн ₃) ₃ с-	94
234	CH3	снз	6-CH3	(сн ³) ⁵ сн-	снз	H	(сн ₃) ₂ -сн-с(сн ₃) ₂ -	
235	CH3	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	CH ³	H	(сн ₃)3с-сн ⁵ -	Öl
236	CH ³	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	снз	н	сн ₃ 0-сн ₂ -с(сн ₃) ₂	!
237	CH3	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	снз	н	стсн ² -с(сн ³) ² -	112 -
238	снз	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	CH3	н	сн ³ о сн ³	
239	сн3	снз	6-CH3	(CH3)2CH-	снз	н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
240	CH ³	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	снз	н	ОСH ³	
241	CH3	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	C ₂ H ₅ -	H	СН ₃ -	
242	CH3	СНЗ	6-CH3	(CH ₃)2CH-	с ₂ н ₅ -	H	(сн ₃) ₂ сн-	
243	CH3	СНЗ	6-CH3	(CH3)2CH-	C ₂ H ₅ -	H	(CH ₃) ₃ C-	
244	СНЗ	CH3	6-CH3	(CH3) SCH-	C ₂ H ₅ -	H	(CH ₃) ₂ -CH-C(CH ₃) ₂	;-

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹ Fp °C
	245	CH ³	СН3	6-CH3	(сн ₃)2сн-	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -
10	246	CH3	CH3	6-CH3	(CH3)2CH-	C2H5-	H	CH30-CH2-C(CH3)2-
	247	снз	CH3	6-CH3	(CH3)2CH-	C2H5-	H	C1CH2-C(CH3)2-
15	248	снз	снз	6-CH3	(CH3)2CH-	С ₂ н ₅ -	н	сн ₃ о сн ₃
	249	снз	снз	6-CH3	(CH3)2CH-	C ₂ H ₅ -	н	(CH3)2C=CH-
20 .	250	сн3	сн ₃	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	С ₂ н ₅ -	H	CH3
25	251	СНЗ	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	C3H7-	H	сн ₃ -
25	252	CH ³	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	С ₃ н ₇ -	н	(CH ₃) ₂ CH-
	253	CH3	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	с ₃ н ₇ -	н	(CH3)3C-
30	254	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	С ₃ н ₇ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -
	255	CH3	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	(CH ₃) ₂ CH-	Н	CH3-
	256	CH ³	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	(CH ₃) ₂ CH-	- н	(CH3)2CH-
35	257	CH3	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	(CH3)2CH-	- н	(CH3)3C-
	258	CH3	CH ³	6-CH3	(CH3)2CH-	(сн ₃)2сн-	- н	(CH3)2CH-C(CH3)2-
40	259	CH ³	сн3	6-CH3	(CH3)2CH-	сн3- (сн ₃ -	СН3-
	260	снз	снз	6-CH3	(CH3)2CH-	сн3- (CH3-	- (сн ₃) ₂ сн-
	261	снз	CH3	6-CH3	(сн3) 2сн-	СН3-	CH3-	- (сн ₃)3с-
45	262	CH3	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	сн3-	сн3.	- (CH ₃) ₂ CH-С(CH ₃) ₂ -

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n _	A	В	C ⁴	R ¹	Fp °C
10	263	CH3	CH3	6-CH3	C4H9-	H	H	СН ₃ -	
	264	CH ³	CH3	6-СН ^З	C4H9-	н	Н	(сн ₃) ₂ сн-	
	265	CH3	CH3	6-СН ^З	C4H9-	Н	н	(сн ³) ³ с-	
15	266	CH3	сн3	6-CH3	C4H9-	Н	Н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	
	267	CH ³	сн3	6-CH3	C4H9-	CH3-	Н	сн3-	
20	268	CH3	сн3	6-CH3	C4H9-	сн3-	Н	(сн ₃) ₂ сн-	
	269	сн3	сн3	6-CH3	C4H9-	СН3-	Н	(СН ³) ³ С-	
	270	CH3.	сн3	6-CH3	C4H9-	сн3-	Н	(CH3)2CH-C(CH3)2-	
25	271	сн3	сн3	6-CH3	(сн ₃)2сн-сн ₂	- н	Н	сн ₃ -	. Ö1
	272	сн3	CH3	6-CH3	(CH3)2CH-CH2	- н	н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
30	273	сн3	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	- н	Н	(СН ³) ³ С-	<u>.</u> .Ö1
	274	снз	снз	6-CH3	(CH3)2CH-CH2	- н	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	Öl
	275	снз	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	- сн3-	Н	. сн ₃ -	73
35	276	сн3	снз	6-CH3	(CH3)2CH-CH2-	- сн ₃ -	н	(CH3)3C-	Öl
	277	сн3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	- сн ₃ -	Н	(CH3)3C-CH2-	Öl
40	278	сн3	CH3	6-CH3	(CH3)2CH-CH2-	- сн3-	Н	(CH ₃) ₂ CH-С(CH ₃) ₂ -	
	279	снз	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ сн ₃	Н	Н	сн3-	Öl
45	280	СНЗ	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ сн-	н	н	(сн ₃) ₂ сн-	66

50

<u>Tabelle 2</u>. (Fortsetzung)

5	Bsp.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	281	сн3	сн3	6-СН ³	С ₂ Н ₅ СН-	н	н	(CH3)3C-	99
15	282	СНЗ	сн3	6-CH ₃	с ₂ н ₅ сн-	н	н ((СН ₃) ₂ СН-С(СН	1 ₃) ₂ - 66
	283	снз	сн3	6-CH3	С ₂ Н ₅ СН-	сн3-	н	сн ³ -	Öl
20	284	сн3	сн ₃	6-CH3	с ₂ н ₅ сн ₃	сн ₃ -	н	(сн ₃) 2сн-	
25	285	CH3	СН3	6-CH3	с ₂ н ₅ сн ₃	сн ₃ -	н	(сн ₃)3с-	100
30	286	СН _З	снз	6-CH ³	С ₂ Н ₅ СН ₃	сн3-	н	(сн ₃) ₂ сн-с (сн	l ₃) ₂ -
	287	сн3	снз	6-CH3	(CH3)3C-	н	Н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
35	288	снз	сн3	6-CH3	(CH3)3C-	H	н	(сн3)3с-	85
	289.	сн3	снз	6-CH3	(CH ₃) ₃ C-	н	Н	(сн ₃) ₂ сн-с (с	H ₃) ₂ - 107
	290	снз	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	н	Н	CH3-	Öl
40	291	CH3	сн ³	6-CH3	(CH3)3C-CH2-	н	H	(CH3)2CH~	
	292	CH3	CH3	6-CH3	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	н	Н	(CH3)3C-	83
45	293	CH2	CH2	6-CH ₂	(CH ₂) ₂ C-CH ₂ -	н	н	(CH ₂) ₂ CH-C(0	H ₂) ₂ -

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

					•			
Bsp. Nr.	x	Y	z _n	A	В	c*	R ¹	Fp °C
294	CH3	сн3	6-CH ₃	(сн ₃)2сн-сн(сн ₃	3)- H	н	сн ₃ -	
295	CH3	СНЗ	6-CH3	(сн ₃)2сн-сн(сн ₃	3)- н	н	(CH3)2CH-	
296	CH3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃	3)- Н	н	(сн ₃)3с-	
297	CH3	CH3	6-CH3	(сн ₃)2сн-сн(сн ₃	3)- H	н	(сн ₃) ₂ сн-с (сн ₃) ₂	-
298	сн3	снз	6-СН ^З	(CH3)3C-CH(CH3)	- н	н	сн3-	Öl
299	снз	CH3	6-СН ^З	(CH3)3C-CH(CH3)	- н	н	(сн ₃)2сн-	
300	CH3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)	- н	н	(сн ³) ³ с-	92
301	CH3	CH3	6-CH3	(CH3)3C-CH(CH3)	- н	н	(СН ₃) ₂ СН-С(СН ₃) ₂	-
302	CH3	снз	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	н	н	сн3-	Öl
303	СНЗ	CH3	6-CH3	CH2=CH-CH2-	н	н	(CH ₃) ₂ CH-	
304	СНЗ	СНЗ	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	н	н	(сн ₃) ₃ с-	Öl
305	CH3	CH3	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	н	н	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃) ₂	-
306	CH3	СНЗ	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	сн3-	Ĥ	сн ₃ -	
307	СНЗ	СНЗ	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	CH3-	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
308	СНЗ	CH3	6-CH3	CH2=CH-CH2-	сн3-	н	(CH3)3C-	
309	СНЗ	CH3	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	сн3-	н	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃) ₂	·-
310	СНЗ	CH3	6-CH3	>	н	н	сн3-	Öl
311	СНЗ	СНЗ	6-CH3	>	н	н	(CH ₃) ₂ CH-	35
312	СНЗ	CH ³	6-CH3	>	н	н	(CH ₃) ₃ C-	75
313	CH3	CH3	6-CH3	D	н	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂	,-

50

Tabelle 2 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	Zn	λ	B	c*	R ¹	Fp °C
	314	CH ³	СН3	6-CH3	>	H	Н	(сн3)3с-сн	2-
10	315	CH3	СНЗ	6-CH3	>	н	Н	сн ₃ 0-сн ₂ -с(сн ₃)2-
	316	сн3	сн3	6-CH ³	> -	н	н	стсн ² -с(сн	3)2-
15	317	снз	CH ³	6-CH3	>	н	н	сн ³ 0	<сн ₃
	318	CH3	CH3	6-CH3	> -	н	Н	(CH3)2C=CH	-
20	319	СНЗ	СНЗ	6-CH3	> -	н	н	$\langle \sum \rangle$	Н3
25	320	CH3	CH3	6-CH3	D —	CH ³	н	сн ₃ -	83
	321	CH3	CH3	6-CH3	>	CH3	н	(CH3)2C	H-
	322	CH3	CH3	6-СН ^З	>	CH3	н	(CH3)3C	- Ö1
30	323	CH3	СНЗ	6-CH3	>	сн3	н	(сн ₃) ₂ -сн-с	(CH ₃) ₂ -
	324	CH3	СНЗ	6-CH3	>	CH3	H	(сн ₃)3с-	сн ₂ - ö1
35	325	CH3	CH3	6-CH3	>	снз	н	сн ₃ о-сн ₂ -	с(сн ₃) ₂ -
	326	CH3	CH3	6-CH3	D —	CH3	H	C1CH2-C(CH ₃) ₂ -
40	327	CH3	СНЗ	6-CH ₃	> -	CH ³	н	сн ₃ о√	CH3
	328	CH3	CH3	6-CH3	>	CH ³	H	(CH3)2C=	CH-
45	329	снз	сн3	6-CH3	> —	сн3	н	$\langle \rangle \times$	CH3

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	330	CH3	снз	6-CH3	>	С ₂ Н ₅ -	н	сн ₃ -	
7 0	331	снз	CH3	6-СН3	>	С ₂ Н ₅ -	Н	(СН ₃) ₂ СН-	
	332	CH ³	снз	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	H	(CH ₃)3C-	
15	333	CH3	CH3	6-сн3	D —	С ₂ Н ₅ -	Н	(CH ₃) ₂ -CH-C(CH	3 ⁾ 2 ⁻
	334	CH3	сн3	6-CH3	D -	С ₂ н ₅ -	н	(сн ₃)3с-сн ₂ .	•
20	365	CH3	CH3	6-СН3	>	С ₂ Н ₅ -	н	сн ₃ 0-сн ₂ -с (сн	3 ⁾ 2 ⁻
20	336	CH3	CH ³	6-CH3	>	С ₂ Н ₅ -	H	с1сн2-с(сн3)	2*
25	337	сн3	сн3	6-СН ^З	>	с ₂ н ₅ -	н	сн ³ 0 Сн	1 ₃
	338	CH3	CH3	6-CH3	>	С ₂ н ₅ -	Н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
30	339	сн3	снз	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	Н	ОСH ³	
	340	CH3	CH3	6-CH3	>	C3H7-	н	СН3-	
35	341	CH3	СНЗ	6-CH3	>	С ₃ н ₇ -	н	(сн ₃)2сн-	
	342	CH3	CH3	6-CH3	>	С ₃ н ₇ -	н	(сн3)3с-	
40	343	CH ³	СНЗ	6-CH3	>	С ₃ Н ₇ -	H	(сн3)2сн-с(сн3)	2-
40	344	CH3	CH3	6-CH3	>	(CH ₃) ₂ CH-	н	СН3-	
	345	CH3	CH3	6-CH3	>	(сн ₃)2сн-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
45	346	СН3	CH3	6-CH3	. •	(сн ₃) ₂ сн-	Н	(CH3)3C-	
	347	СНЗ	CH3	6-CH3	>	(CH ₃)2CH-	н	(сн ₃)2сн-с(сн ₃)	2-

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

Bsp.	X	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	-Fp °C
348	СНЗ	CH3	6-CH3	>	сн3-	сн3-	сн ₃ -	
349	СНЗ	CH3	6-CH3	>	сн3-	сн3-	(CH3)2CH-	
350	CH3	CH3	6-CH3	>	сн3-	сн3-	(CH3)3C-	
351	CH ³	СН3	6-CH3	>	сн3-	сн3-	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃) ₂ -
352	CH3	снз	6-CH3	\bigcirc	н	н	сн3-	60
353	CH3	сн3	6-CH3	\bigcirc	Н	н	(CH3)2CH-	Öl
354	CH3	снз	6-CH3	\bigcirc	н	н	(сн ³) ³ с-	80
355	сн3	сн3	6-CH3		H	н (С	:н ₃) ₂ -сн-с(сн ₃)	2- 85
356	CH3	сн3	6-CH3	\bigcirc	н	н	(сн ₃)3с-сн ₂ -	74
357	CH3	CH ³	6-сн3	\bigcirc	н	н	сн ₃ о-сн ₂ -с(сн ₃)	2-
358	CH3	CH3	6-CH3	\Box	H	Ή	С1СH ₂ -С(СH ₃) ₂ -	94
359	СНЗ	снз	6-CH3	\Box	н	н	сн30 сн3	39

50

Tabelle 2 (Fortsetzung)

5	Bsp.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	360	сн3	сн3	6-сн3		н	н	(CH ₃) ₂ C=CH-	Öl
15	361	снз	сн3	6-СН ³	\Box	н	н	CH ₃	:
	362	снз	сн3	6-СН3		сн ₃ -	н	сн ₃ -	96
20	363	снз	сн3	6-CH ³	\Box	сн3-	н	(сн ₃)2сн-	Öı
25	364	CH3	снз	6-CH ₃	\Box	сн ₃ -	н	(сн ³) ³ с-	63
30	365	снз	сн3	6-CH ³	\Box	сн3-	н (СН _З) ₂ СН-С (СН _З	₃) ₂ - Ö1
35	366	снз	снз	6-CH3	\Box	сн ₃ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂	, -
	367	сн3	снз	6-CH ³	\Box	сн3-	н	сн ₃ 0-сн ₂ -с(сн	3)2-
40	368	снз	СНЗ	6-CH3	\Box	сн3-	н.	сісн ₂ -с(сн ₃)	2*
45	369	снз	СНЗ	6-CH ₃	\Box	сн3-	н	сн ₃ о	н ₃

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	Z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	370	CH3	cH ³	6-СН ^З	\Box	СН3-	н	(сн ₃) ₂ с=сн-	
15	371	сн3	сн3	6-СН _З		сн3-	н	(CH3	
	372	сн3	сн3	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	сн3-	
20	373	сн3	сн3	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
25	374	сн3	сн3	6-CH3	\Box	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₃ с-	
30	375	снз	снз	6-СН ^З	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₂ -сн-с(сн	3 ⁾ 2 ⁻
35	376	снз	сн ₃	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂	-
	377	сн3	CH3	6-CH ₃		C ₂ H ₅ -	н	сн ₃ о-сн ₂ -с(сн	3 ⁾ 2 ⁻
40	378	СН3	CH3	6-CH3	\Box	с ₂ н ₅ -	Н	сісн ₂ -с(сн ₃)	2-
45	379	CH3	СН3	6-CH ₃	\Box	C ₂ H ₅ -	н	CH30 C	н ₃

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp.	X	Y	z _n	λ	В	C*	R1	Fp °C
10	380	снз	снз	6-СН _З	\Box	С ₂ Н ₅ -	н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
15	381	снз	снз	6-СН _З	\Box	с ₂ н ₅ -	н	С Сн ³	
	382	снз	CH3	6-CH3	\bigcirc	С ₃ Н ₇	н	сн3-	
20	383	сн3	сн3	6-CH3	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
25	384	снз	снз	6-СН _З		С ₃ н ₇ -	н	(CH3)3C-	
30	385	CH3	снз	6-СН _З	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	Ĥ	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃)	2-
35	386	снз	СН3	6-сн3	\bigcirc	(CH ₃) ₂ CH-	н	сн3-	
	387	СНЗ	СНЗ	6-сн3	\bigcirc	(CH ₃) ₂ CH-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
40	388	сн3	сн3	6-СН _З	\Box	(сн ₃)2сн-	н	(CH3)3C-	
45	389	СНЗ	снз	6-CH3	\Box	(CH ₃)2CH-	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃)	2-

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

Bsp.	x	Y	z _n	A	В	C*	R ¹	Fp °C
390	сн3	сн3	6-CH3		сн3-	сн ₃ -	сн3-	
391	сн3	СН3	6-CH3	\Box	сн3-	сн3-	(сн ₃) ₂ сн-	
392	сн3	CH3	6-СН _З	\bigcirc	сн3-	сн ₃ -	(CH ₃) ₃ C-	
393	СНЗ	снз	6-CH3	\Box	сн ₃ -	СН ₃ -	(СН3)2СН-С(СН3))2-
394	сн3	CH3	6-CH ₃	<u></u>	н	H	сн3-	78
395	сн3	сн3	6-CH ₃	<u></u>	н	Н	(сн ₃) ₂ сн-	Öl
396	снз	сн3	6-CH3	\bigcirc	н	н	(сн ₃) ₃ с-	97
397	сн3	сн3	6-CH3	<u> </u>	н	н	(СН ₃) ₂ СН-С(СН ₃)	2- 122
398	CH3	СНЗ	6-CH3	\bigcirc	н	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
399	СНЗ	сн3	6-CH3	\bigcirc	н	H	сн ₃ о-сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -

50

Tabelle 2 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.		Y	z _n	A	В	C*	R ¹	Fp °C
10	400	сн3	сн3	6-СН ^З	<u></u>	н	н	C1CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -	
15	401	CH3	сн3	6-СН3	\bigcirc	н	н	сн ₃ о сн ₃	
	402	CH3	снз	6-сн3	\bigcirc	н	н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
20	403	СН3	сн3	6-CH3	<u></u>	н	н	OCH ³	
25	404	снз	снз	6-СН ³	\bigcirc	сн ₃ -	н	сн3-	84
30	405	сн3	CH3	6-СН ^З		сн ₃ -	H	(сн ₃) ₂ сн-	Öı
35	406	сн3	снз	6-СН ^З	\bigcirc	сн3-	н	(CH ³) ³ C-	72
	407	снз	CH3	6-CH ₃	\bigcirc	сн3-	н (сн ₃) ₂ -сн-с(сн ₃)	2-
40	408	снз	снз	6-CH ₃	\bigcirc	сн ₃ -	н	(СН ₃) ₃ С-СН ₂ -	118
45	409	СНЗ	снз	6-CH3	<u></u>	сн3-	н :	сн ₃ 0-сн ₂ -с (сн ₃);	2-

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	410	CH3	СНЗ	6-CH3	\bigcirc	сн ₃ -	н	с1сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -	115
15	411	CH3	снз	6-CH3	\bigcirc	сн3-	н	сн30	3
	412	сн ³	сн3	6-CH ³	\bigcirc	сн3-	Н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
20	413	сн3	сн3	6-CH3	\bigcirc	сн3-	н	(0 CH3	
25	414	снз	снз	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	сн ³ -	
30	415	снз	сн3	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
35	416	CH3	CH3	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅	н	(CH3)3C-	
	417	сн3	CH3	6-CH3	\bigcirc	С ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₂ сн-с (сн ₃)	2-
40	418	сн3	сн3	6-CH3	<u></u>	С ₂ Н ₅ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
45	419	сн3	сн3	6-CH3	<u></u>	с ₂ н ₅ -	н	сн ₃ о-сн ₂ -с(сн ₃	,) ₂ -

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.		Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	420	CH3	СН3	6-CH ₃		с ₂ н ₅ -	н	стсн2-с(сн3)	2-
15	421	сн3	СН3	6-CH ₃	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	H	сн ³ 0 си	H ₃
20	422	сн3	CH3	6-CH ₃	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	(СН ₃) ₂ С=СН-	
	423	сн3	сн3	6-CH ₃	<u></u>	с ₂ н ₅ -	H	0CH ³	
25	424	СНЗ	CH3	6-CH ₃	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	н	сн ₃ -	
30	425	снз	CH ³	6-CH3	\bigcirc	С ₃ Н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
35	426	СНЗ	СНЗ	6-CH ₃	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	н	(CH3)3C-	
. 40	427	CH3	СН3	6-CH3	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	н (сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃)2-
40	428	CH3	сн3	6-сн3		(сн ³) ^S сн-	. н	сн ₃ -	
45	429	CH3	снз	6-CH ³	<u></u>	(сн ₃) ₂ сн-	. н	(CH ₃) ₂ CH-	

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ .	В	c*	R ¹	Fp °C
10	430	сн3	СН3	6-СН _З	\bigcirc	(CH3)2	Сн- н	(сн ³)³с-	
15	431	сн3	снз	6-CH3	\bigcirc	(CH ₃)2	СН- Н	(сн ₃) ₂ сн-с	(сн ³) ⁵ -
	432	сн3	снз	6-CH3	\bigcirc	сн3-	сн3-	сн3-	
20	433	сн3	CH ³	6-CH3	\bigcirc	сн3-	сн3-	(CH ₃) ₂ CH-	
25	434	сн3	снз	6-CH ₃	\bigcirc	сн3-	сн3-	(сн ₃)3с-	
30	435	CH3	сн3	6-CH3	\bigcirc	сн3-	сн3-	(сн ₃) ₂ сн-с	(CH ₃) ₂ -
35	436	снз	снз	6-CH ₃		н	н	сн ₃ -	Öl
	437	сн3	снз	6-CH ₃		н	н	(сн ₃)2сн	-
40	438	снз	-сн3	6-СН _З		н	н	(сн ₃) ₃ с-	104
45	439	снз	сн3	6-СН3		н	H ((СН ₃) ₂ -СН-С(СН ₃) ₂ -

50

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

55

5	Bsp Nr.	. x	Y	z _n	λ		В	c*	R^1	Fp °C
	440	CH3	снз	6-CH ₃	сн ₃ -о-сн ₂ -	сн(сн ₃)-	н	н	сн ₃ -	76
10	441	CH3	CH3	6-CH3	сн3-о-сн5-	сн(сн3)-	н	Н	(CH3)2CH-	
	442	CH3	СНЗ	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -	CH(CH ³)-	H	Н	(сн ³) ³ с-	Öl
15	443	СНЗ	CH3	6-СН ³	сн3-о-сн5-	сн(сн ₃)-	н	н	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃) ₂	2-
	444	CH3	CH3	6-СН ^З	сн ³ 0-(с	H2)2-	H .	н	сн3-	Öl
	445	сн ³	CH3	6-CH ³	сн ³ 0-(с	H ₂) ₂ -	Н	Н	(CH3) SCH-	Öl
20	446	сн3	CH ³	6-CH3	сн ³ 0-(с	H ₂)2-	H	Н	(сн ³) ³ с-	Öl
	447	CH3	CH3	6-CH3	сн ³ о-(с	H ₂) ₂ -	Н	Н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	Öl
25	448	CH3	CH3	6-СН ^З	сн ³ 0-(С	H ₂) ₂ - C	н3-	Н	сн ₃ -	Öl
	449	сн3	CH3	6-СН ^З	сн ³ 0-(с	H ₂) ₂ - C	н ₃ -	Н	(сн ₃) ² сн-	Öl
	450	CH ³	CH3	6-CH3	сн ³ о- (с	H ₂) ₂ - C	н ₃ -	Н	(сн ₃) ₃ с-	Öl
30	451	CH3	сн3	6-CH3	сн ³ о-(с	H ₂) ₂ - C	н3-	Н	(CH3) SCH-C(CH3) S-	- Ö1
	452	CH3	СНЗ	6-CH3	сн ³ о- (с	H ₂) ₃ -	Н	Н	сн3-	Öl
35	453	сн3	СНЗ	6-CH3	сн ³ о- (с	H ₂) ₃ -	н	Н	(сн ₃)2сн-	Öl
	454	СНЗ	СНЗ	6-CH3	сн ³ 0-(с	H ₂) ₃ -	н	Н	(сн ₃)3с-	Öl
	455	снз	снз	6-CH3	сн ³ о- (с	H ₂) ₃ -	н	Н	(CH3)2CH-C(CH3)2	- Ö1
40	456	СН3	СНЗ	6-CH3	сн ³ 0-(с	н ₂) ₃ - с	н ₃ -	Н	снз-	Öl
	457	СНЗ	сн3	6-CH3	CH ³ 0-(C	H ₂) ₃ - C	H ₃ -	H	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
45	458	CH3	сн3	6-CH3	сн ³ 0-(с	H ₂) ₃ - C	H3-	H	(сн ₃) ₃ с-	Öl
	459	CH3	сн3	6-CH3	сн ³ 0-(с	H ₂) ₃ - C	H3-	Н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃)	2- Ö1

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

Bsp.	X	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
460	снз	СНЗ	6-CH3	С ₂ H ₅ O-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)	- н	н	сн ₃ -	Öl
461	снз	сн3	6-CH3	C2H50-(CH2)2-CH(CH3)	- н	н	(CH ₃)2CH-	Öl
462	сн3	снз	6-CH3	C2H50-(CH2)2-CH(CH3)	- н	н	(сн ₃) ₃ с-	Öl
463	CH3	сн3	6-CH3	C2H50-(CH2)2-CH(CH3)	- н	н	(CH3) SCH-C(CH3)	2- Ö1
464	CH3	снз	6-CH3	сн ₃ о-сн ₂ -сн(сн ₃)-сн-	. н	Н	Сн ³ -	Öl
465	CH3	сн3	6-CH3	сн ₃ о-сн ₂ -сн(сн ₃)-сн-	Н	Н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
466	снз	сн3	6-CH ³	сн30-сн2-сн(сн3)-сн-	н	н	(CH3)3C-	Öl
467	снз	снз	6-CH3	сн ₃ о-сн ₂ -сн(сн ₃)-сн-	н	н	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃)	2- Öl
468	сн3	снз	6-СН ^З	C2H5-S-(CH2)2-	н	н	CH3-	Öl
469	CH3	снз	6-CH3	C2H5-S-(CH2)2-	н	H	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
470	CH3	CH3	6-CH3	C2H5-8-(CH2)2-	н	н	(CH3)3C-	Öl
471	CH ₃	CH3	6-CH ₃	C2H5-S-(CH2)2-	н	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃)	₂ - Öl

Tabelle 3

15	Bsp. Nr.	X	Y	z _n	λ		В	c *	R ¹	Fp °C
	472	сн3	CH ³	6-СН ^З	СН3-		н	н	СН3-	
20	473	CH3	сн3	6-CH3	сн3-		H.	н	C ₂ H ₅ -	ı
	474	CH3	сн3	6-CH3	сн3-		н	H	(CH ₃) ₂ CH-	•
	475	CH3	CH3	6-CH ³	сн3-		н	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
25	476	снз	снз	6-CH3	сн3-		н	н	С ₂ Н ₅ СН-	
30	477	сн3	CH3	6-CH3	сн3-		н	н	(СН ₃)3С-СН ₂ -	
	478	CH3	снз	6-СН ^З	сн3-		н	н	<u></u>	
35	479	снз	СНЗ	6-CH ₃	сн ₃ -	÷	н	н	\bigcirc	
40	480	снз	сн3	6-CH3	сн3-		сн3-	н	сн ₃ -	
	481	CH3	сн3	6-CH ³	сн3-		сн3-	н	C ₂ H ₅ -	Öl
45	482	CH3	CH3	6-CH3	сн3-		сн3-	H	(CH ₃) ₂ CH-	Öı
	483	CH3	CH3	6-CH3	сн3-		сн3-	H	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	Öl

50

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
10	484	снз	снз	6-CH ₃	сн3-	сн ₃ -	Н	С ₂ Н ₅ СН-	Öl
	485	CH ³	СНЗ	6-CH3	сн3-	сн3-	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	146
15	486	сн3	сн3	6-CH3	сн3-	CH3-	н	\bigcirc	
20	487	снз	сн3	6-СН ^З	сн3-	сн3-	н	\bigcirc	
	488	CH3	сн ₃	6-CH ₃	сн3-	с ₂ н ₅ -	н	сн ₃ -	
25	489	CH3	CH3	6-CH3	сн3-	с ₂ н ₅ -	н	C2H5-	
	490	CH3	CH3	6-CH3	сн3-	С ₂ Н ₅ -	н	(CH ₃) ₂ CH-	
30	491	СНЗ	CH ³	6-CH3	сн3-	С ₂ Н ₅ -	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
30	492	снз	CH3	6-CH ³	сн3-	с ₂ н ₅ -	н	С2 ^H 5 СH-	
35	493	CH ³	снз	6-CH3	сн3-	с ₂ н ₅ -	н	(CH ³) ³ C-CH ⁵ -	
	494	СНЗ	сн3	6-СН _З	сн3-	с ₂ н ₅ -	н	\bigcirc	
40	495	снз	сн3	6-CH ₃	сн3-	с ₂ н ₅ -	н		
45	496	CH3	СНЗ	6-CH ₃	сн3-	С ₃ Н ₇ -	Н	С ₂ н ₅ -	
	497	CH3	CH3	6-CH ₃		C3H7-	н	(CH ₃) ₂ CH-	

50

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	X	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
	498	сн3	сн3	6-CH3	CH3-	С ₃ Н ₇ -	н	(сн ₃)2сн-сн ₂ -	
10	499	сн3	сн3	6-CH3	сн3-	С ₃ Н ₇ -	Н	СН ₃ СН-	
15	500	CH3	снз	6-CH ₃	сн3-	(сн3) 5сн-	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	•
73	501	CH ³	СНЗ	6-CH3	сн3-	(сн ₃)2сн-	н	с ₂ н ₅ -	
	502	Сн3	CH ³	6-CH3	CH3-	(CH ₃) ₂ CH-	н	(CH3)2CH-	
20	503	снз	СНЗ	6-CH ³	сн3-	(CH ₃) ₂ CH-	н	(сн ₃) 2сн-сн ₂ -	
	504	сн3	CH ³	6-CH3	СН3-	(CH ₃) ₂ CH-	н	СН ₃ СН-	
25	505	СНЗ	СНЗ	6-CH3	сн3-	(СН ₃) ₂ СН-	н	(сн ₃)3с-сн ₂ .	-
	506	CH3	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	н	н	сн ₃ -	
30	507	CH3	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ -	н	н	С ₂ Н ₅ -	
	508	CH3	CH ³	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	н .	н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
	509	СНЗ	сн3	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	н	Н	(CH3)2CH-CH2-	
35	510	снз	снз	6-CH ₃	с ₂ н ₅ -	. н	н	с ₂ н ₅ сн-	
40	511	CH3	снз	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	н	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
40	512	СНЗ	снз	6-СН _З	с ₂ н ₅ -	н	н	\bigcirc	
45	513	CH3	снз	6-CH ₃	с ₂ н ₅ -	н	. н		

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp
514	снз	СНЗ	6-СН3	с ₂ н ₅ -	сн ₃ -	н	сн3-	
515	сн3	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	сн3-	H	C2H5-	Ċ
516	снз	сн3	6-CH3	C2H5-	сн3-	н	(сн ₃)2сн-	
517	· CH3	CH3	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	CH3-	Н	(сн ₃) ² сн-сн ² -	
518	сн3	CH ³	6-CH ₃	с ₂ н ₅ -	сн3-	н	С ₂ Н ₅ СН-	
519	CH3	CH3	6-CH3	C2H5-	сн3-	Н	(СН ₃) ₃ С-СН ₂ -	
520	CH3	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ -	сн3-	н	\bigcirc	
521	снз	сн3	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	сн3-	н		
522	сн3	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	С ₂ Н ₅ -	н	сн ₃ -	
523	СНЗ	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	с ₂ н ₅ -	Н	C2H5-	
524	CH3	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ -	с ₂ н ₅ -	н	(CH ₃)2CH-	
525	CH3	CH3	6-CH3	C2H5-	С ₂ н ₅ -	н	(CH ₃)2CH-CH2	•
526	снз	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ -	с ₂ н ₅ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
527	CH3	CH3	6-CH3	C ₂ H ₅ -	с ₂ н ₅ -	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ .	-
528	СНЗ	CH3	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	с ₂ н ₅ -	н	\frown	•

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	X	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp ° (
529	сн3	сн3	6-СН _З	с ₂ н ₅ -	с ₂ н ₅ -	н		
530	CH3	CH ³	6-CH3	с ₂ н ₅ -	С ₃ Н ₇ -	н	C ₂ H ₅ -	
531	CH3	CH ³	6-CH3	с ₂ н ₅ -	С ₃ н ₇ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-	•
532	снз	CH3	6-CH ³	c2H2-	С ₃ Н ₇ -	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	-
533	сн3	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	с ₃ н ₇ -	н	CH ₃ CH- C ₂ H ₅	
534	CH3	сн3	6-CH3	C ₂ H ₅ -	(CH3)2CH-	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂	-
535	снз	CH ³	6-CH ³	с ₂ н ₅ -	(CH ₃) ₂ CH-	н	C ₂ H ₅ -	
536	CH ³	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	(CH3)2CH-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
537	CH ³	CH ³	6-CH3	с ₂ н ₅ -	(CH ₃) ₂ CH-	н	(сн ₃) 2сн-сн ₂	-
538	снз	снз	6-СН <mark>З</mark>	с ₂ н ₅ -	(сн ₃) ₂ сн-	H	сн ₃ сн-	
539	CH3	снз	6-CH3	C ₂ H ₅ -	(сн ₃) ₂ сн-	Н	(CH3)3C-CH5	-
540	CH3	снз	6-CH3	C3H7-	H	Н	сн3-	
541	CH3	CH3	6-CH3	C3H7-	н	H	C ₂ H ₅ -	
542	CH3	снз	6-CH3	C3H7-	н	H	(CH ₃) ₂ CH-	
543	CH3	CH3	6-CH3	C3H7-	н	н	(CH3)2 CH-CH2	-
544	СНЗ	CH3	6-СН3	С ₃ Н ₇ -	H	н	С ₂ Н ₅ СН-	

50

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
	545	сн3	сн3	6-СН3	С ₃ н ₇ -	н	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
10	546	сн ₃	сн3	6-CH3	C ₃ H ₇ -	н	н	<u></u>	
15	547	сн3	сн3	6-СН3	С ₃ н ₇ -	Н	н		
20	548	CH3	сн3	6-CH3	C3H7-	сн3-	н	сн3-	
	549	CH3	CH3	6-CH3	С ₃ н ₇	сн3-	н	C ₂ H ₅ -	
	550	CH ³	CH3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
25	551	CH ³	CH ³	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
3 <i>0</i>	552	сн3	сн3	6-СН ^З	С ₃ Н ₇ -	сн3-	н	с ₂ н ₅ сн-	
	553	сн3	сн3	6-CH3	с ₃ н ₇ -	сн3-	н	(CH3)3C-CH2-	
35	554	сн3	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	сн3-	н	\bigcirc	
40	5 55	CH3	CH3	6-CH ₃	C ₂ H ₅ -	сн3-	н	\bigcirc	
	556	CH3	CH3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	C ₂ H ₅	н	сн ₃ -	
	557	CH3	CH ₃	6-CH3	C ₃ H ₇ -	C ₂ H ₅ -	H	C ₂ H ₅ -	•
45	558	СНЗ	CH3	6-CH3		C ₂ H ₅ -	н	-	

50

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

					•			
Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp ° (
559	сн3	СНЗ	6-сн ₃	с ₃ н ₇ -	С ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂	-
560	сн3	CH ³	6-СН _З	С ₃ Н ₇ -	с ₂ н ₅ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
561	снз	сн3	6-CH3	C3H7-	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂	•
562	снз	CH3	6-CH3	с ₃ н ₇ -	С ₂ Н ₅ -	H	\bigcirc	
563	сн3	CH ³	6-CH3	C3H7-	с ₂ н ₅ -	н		
564	CH3	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	с ₃ н ₇ -	H	c ₂ H ₅ -	
565	снз	снз	6-CH3	C3H7-	С ₃ Н ₇ -	н	(CH ₃) ₂ CH-	
566	снз	снз	6-CH3	C3H7-	С ₃ Н ₇ -	н	(сн3) 2сн-сн	1 ₂ -
567	снз	снз	6-CH3	с ₃ н ₇ -	С ₃ н ₇ -	н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
568	сн3	снз	6-CH3	С ₃ н ₇ -	с ₃ н ₇ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн	1 ₂ -
569	CH3	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	(сн ₃)2сн-	н	с ₂ н ₅ -	
570	CH3	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	(CH3) ² CH-	н	(сн ₃)2сн-	
571	CH3	CH3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	(сн3)2сн-	H	(CH3)2CH-CH	12-
572	снз	СНЗ	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	(сн ₃)2сн-	H	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
573	СНЗ	CH3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	(CH ₃) ₂ CH-	Н	(CH3)3C-CI	H ₂ -

55

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp ° (
574	сн3	снз	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-	н	Н	сн ₃ -	67
575	снз	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	H	Н	c ₂ H ₅ -	87
576	снз	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	Н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	41
577	снз	снз	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-	н	н	с ₂ н ₅ сн-	83
578	CH3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	Öl
579	сн ₃	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	н	\bigcirc	
580	снз	сн3	6-CH ₃	(CH ³) ^S CH-	сн3-	Н	сн3-	
581	сн ₃	снз	6-CH3	(сн ₃) 2сн-	сн3-	н	с ₂ н ₅ -	
582	сн3	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	сн3-	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
583	сн3	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	СН3-	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
584	снз	снз	6-CH ³	(СН3)2СН-	сн3-	н	С ₂ н ₅ сн-	
585	снз	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	сн ₃ -	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	83
586	сн3	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	сн ₃ -	н	\bigcirc	
587	сн3	CH3	6-сн ₃	(сн ₃) ₂ сн-	сн3-	Н	<u></u>	

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
	588	сн3	сн3	6-CH3	(CH3)2CH-	С ₂ Н ₅ -	н	сн3-	
10	589	CH3	CH3	6-CH3	(сн3) 5сн-	C ₂ H ₅ -	Н	C ₂ H ₅ -	
	590	CH3	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	с ₂ н ₅ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
15	591	сн3	CH3	6-CH3	(сн ₃)2сн-	c ₂ H ₅ -	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
	592	сн3	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	с ₂ н ₅ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
20	593	сн3	сн3	6-CH3	(сн ₃)2сн-	c ₂ H ₅ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
25	594	снз	сн3	6-СН _З	(сн ₃) ₂ сн-	C ₂ H ₅ -	н	\bigcirc	
	595	сн3 -	снз	6-сн3	(сн ₃) ₂ сн-	с ₂ н ₅ -	н		
30	F0/	CII	011		/611 \ A11				-
	596	CH3	CH3		(CH ₃) ₂ CH-	С ₃ Н ₇ -	Н	С ₂ Н ₅ -	
	597	снЗ	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	С ₃ Н ₇ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
35	598	снз	CH3	6-CH3	(CH3)2CH-	C3H7-	Н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
40	599	снз	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	C ₃ H ₇ -	H	CH ₃ CH-	
-10	600	сн3	CH3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	С ₃ Н ₇ -	H	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	601	СНЗ	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	(CH ₃) ₂ CH-	Н	С ₂ Н ₅ -	
45	602	CH3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	(сн ₃) ₂ сн-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
	603	CH3	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	(CH ₃) ₂ CH-	н	(сн ₃)2сн-сн ₂ -	

50

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
10	604	сн3	сн3	6-сн ₃	(сн ₃) ₂ сн-	(сн ₃)2сн	- н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
	605	CH3	сн3	6-CH3	(сн ₃) 2сн-	(CH ₃) ₂ CH-	. н	(сн ₃)3с-сн ₂ -	
15	606	CH3	сн3	6-CH3	C4H9-	н	Н	С2H ₅ -	
	607	. сн3	сн3	6-CH3	C4H9-	н	H	(сн ₃)2сн-	
	608	CH3	сн3	6-CH3	C4H9-	н	Н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
20	609	сн3	сн3	6-CH ₃	C4H9-	н	н	СН ₃ СН- С ₂ Н ₅	
25	610	CH3	CH3	6-CH3	C4H9-	н	Н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	, ,
	611	снз	снз	6-CH3	C4H9-	сн ₃ -	Н	С ₂ Н ₅ -	
	612	сн3	сн ₃	6-CH3	C4H9-	сн ₃ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
30	613	снз	снз	6-CH3	C4H9-	сн ³ -	Н	сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
35	614	снЗ	сн3	6-CH3	С ₄ н ₉ -	сн ₃ -	н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
	615	CH3	сн3	6-CH3	C4H9-	сн ³ -	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	616	CH3	CH3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-с	н ₂ - н	Н	С ₂ Н ₅ -	
40	617	снз	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-C	н ₂ - н	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
	618	CH3	CH3	6-CH3	(CH3)2CH-C	н ₂ - н	H	(СН3)2СН-СН2-	
45	619	снз	снз	6-CH ₃	(сн ₃)2сн-с	н ₂ - н	H	сн ₃ сн-	
	620	сн3	CH3	6-CH3	(CH ₃)2CH-C	н ₂ - н	Н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	

50

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
10	621	CH3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	сн3-	H	C ₂ H ₅ -	
	622	CH3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	сн3-	H	(CH ₃) ₂ CH-	
	623	CH3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	CH3-	H	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
15	624	сн3	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	сн3-	H .	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
20	625	сн ³	сн ³	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	сн3-	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	626	сн3	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ сн-	н	н	с ₂ н ₅ -	
25	627	сн3	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ сн-	н	Н	(СН ₃) ₂ СН-	·
30	628	сн3	CH3	6-CH ₃	с ₂ н ₅ сн-	н	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
35	629	CH3	снз	6-CH ₃	с ₂ н ₅ сн-	Н	н	сн ₃ сн-	
40	630	сн3	сн3	6-CH ₃	с ₂ н ₅ сн-	н	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	631	сн3	снз	6-CH ₃	C ₂ H ₅ CH-	сн3-	н	с ₂ н ₅ -	
45	632	сн3	снз	6-CH ₃	с ₂ н ₅ сн-	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-	

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	633	сн ₃	CH3	6-CH ₃	CH-CH3	сн3-	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
. 15	634	сн3	сн3	6-CH ₃	С ₂ Н ₅ СН-	сн3-	н	сн ₃ сн-	
	635	сн3	сн3	6-CH3	С ₂ Н ₅ СН-	сн3-	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
20	636	CH ³	снз	6-CH3	CH2=CH-CH2-	н	Н	C ₂ H ₅ -	
	637	CH3	снз	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	н	Н	(CH3)2CH-	Öl
25	638	снз	снз	6-CH3	CH2=CH-CH2-	н	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂	-
	639	сн3	сн3	6-СН _З	сн ₂ =сн-сн ₂ -	н	н	CH ₃ C ₂ H ₅	
30	640	сн3	сн3	6-CH3	сн2=сн-сн2-	н	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	641	сн3	сн3	6-СН3	~	Н	H	C ₂ H ₅ -	
35	642	сн3	снз	6-CH ₃	<u></u> ^	н	н	(сн ₃)2сн-	Öı
40 .	643	сн3	сн3	6-CH3	<u></u> ^	н	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
45	644	сн3	сн3	6-CH ₃	<u></u> ^	н	H	СН ₃ СН- С ₂ Н ₅	
	645	сн3	сн3	6-CH3	○ ^	н	н	(сн ₃)3с-сн ₂ -	

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	X	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °
646	CH3	CH3	6-СН _З	>	н	Н	CH ₃ -	
647	снз	сн3	6-CH3	>	н	н	С ₂ н ₅ -	
648	снз	снз	6-CH ₃	>	н	Н	(сн ₃) ₂ сн-	
649	сн3	CH3	6-CH3	>	н	Н	(сн ₃)2сн-сн ₂ -	
650	снз	CH3	6-сн3	>	н	н	с ₂ н ₅ сн-	Ö
651	сн3	сн3	6-CH ³	>	н	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
652	сн3	сн3	6-CH3	>	. Н	н	\bigcirc	
653	снз	снз	6-CH3	>	н	н		
654	СНЗ	CH3	6-CH3	>	сн ₃ -	н	сн ₃ -	
655	снз	сн3	6-CH ₃	>	СН3-	Н	C ₂ H ₅ -	
656	снз	сн3	6-CH3	>	CH3~	Н	(сн ₃) ₂ сн-	
657	CH3	сн3	6-CH3	> -	сн3-	H	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
658	сн3	снз	6-CH3	>	СН ₃ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
659	CH3	СНЗ	6-CH3	>	сн3-	н	(CH3)3C-CH2-	
660	снз	снз	6-CH3	>	CH3-	н	<u></u>	
661	сн3	снз	6-CH3	>	СН3-	н		

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	х	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
	662	снз	снз	6-CH ₃	> -	С ₂ Н ₅ -	н	сн ₃ -	
10	663	CH3	CH3	6-CH ₃	>	C ₂ H ₅ -	н	C ₂ H ₅ -	
	664	CH3	снз	6-CH ₃	>	C ₂ H ₅ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
15	665	снз	сн3	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
•	666	сн3	сн3	6-CH ₃	>	с ₂ н ₅ -	н	с ₂ н ₅ сн-	Öı
20	667	снз	CH3	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	н	(сн3)3с-сн5-	
25	668	сн3	CH3	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	н	<u></u>	
	669	снз	снз	6-CH ₃	▶	с ₂ н ₅ -	н		
30	670	CH3	снз	6-CH3	D —	С ₃ Н ₇ -	Н	C ₂ H ₅ -	
	671	снз	снз	6-CH3	>	С ₃ Н ₇ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
35	672	CH3	сн3	6-CH3	> —	с ₃ н ₇ -	Н	(сн ₃)2сн-сн ₂ .	•
	673	сн3	снз	6-CH3	>	с ₃ н ₇ -	Н	СН ₃ СН- С ₂ Н ₅	
40	674	CH3	сн3	6-CH3	D -	с ₃ н ₇ -	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	•
	675	СНЗ	снз	6-CH3	>	(CH ₃) ₂ CH-	H	C2H5-	
45	676	CH3	СНЗ	6-CH ₃	D	(CH ₃) ₂ CH-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
70	677	CH3	CH3	6-CH ₃	D —	(CH ₃)2CH-	H	(СН ₃) ₂ СН-СН ₂ -	•

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	678	снз	сн ₃	6-СН _З	> (сн ₃) ₂ сн-	н	сн ₃ сн-	
	679	сн3	снз	6-CH3	b — (сн ₃) ₂ сн-	Н	(сн ₃)3с-сн ⁵ -	
15	680	сн3	CH3	6-CH3	\bigcirc	н	н	сн ₃ -	70
20	681	сн ₃	снз	6-СН _З	\bigcirc	н	н	С ₂ Н ₅ -	56
	682	сн3	CH3	6-CH3	\bigcirc	н	н	(CH ₃) ₂ CH-	84
25	683	сн3	снз	6-СН _З	\bigcirc	н	н	(сн ₃)2сн-сн ₂ -	69
30	684	сн3	CH ³	6-СН _З	\bigcirc	н	н	с ₂ н ₅ сн ₃	64
35	685	сн3	снз	6-СН3		н	H	(CH3)3C-CH2-	114
	686	CH3	снз	6-СН _З	\Box	Н	н	\bigcirc	
40	687	сн3	СНЗ	6-CH3	\Box	н	Н		

,,

50

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	-688	снз	снз	6-CH ₃		сн3-	н	сн ₃ -	
15	689	снз	CH3	6-CH ₃		сн3-	н	C ₂ H ₅ -	
	690	сн3	сн3	6-CH3	\Box	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
20	691	снз	сн3	6-СН _З		сн ₃ -	н	(сн ₃)2сн-сн ₂ -	
25	692	сн3	сн3	6-CH3	\Box	сн3-	н	С ₂ Н ₅ СН-	
30	693	снз	снз	6-CH3		сн3-	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
95	694	сн3	снз	6-CH3	\Box	сн3-	н	\bigcirc	
35	695	снз	снз	6-CH3		сн3-	н	<u></u>	
40	696	СНЗ	сн3	6-CH ₃		с ₂ н ₅ -	н	сн ₃ -	
45	697	снз	сн3	6-CH ₃	\Box	с ₂ н ₅ -	н	с ₂ н ₅ -	

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	698	снз	снз	6-CH3	\Box	с ₂ н ₅ -	н	(CH ₃) ₂ CH-	
15	699	снз	СНЗ	6-CH ₃	\Box	С ₂ Н ₅ -	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
	700	CH3	снз	6-CH ₃	\Box	С ₂ н ₅ -	н	С ₂ Н ₅ СН-	
20	701	снз	снз	6-CH ₃	\Box	с ₂ н ₅ -	,H	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
25	702	CH3	CH3	6-CH3	\Box	С ₂ н ₅ -	н	\bigcirc	
30	703	сн3	сн3	6-CH3	\Box	с ₂ н ₅ -	Н		
35	704	сн3	снз	6-CH3	\Box	C ₃ H ₇ -	н	С ₂ Н ₅ -	
•	705	сн3	снз	6-CH ₃	\Box	С ₃ Н ₇ -	н	(CH ₃) ₂ CH-	
40	706	снз	сн3	6-СН _Э	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-сн2	-
45	707	СНЗ	снз	6-CH3	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	Н	СН ₃ СН- С ₂ Н ₅	
50	708	СНЗ	СНЗ	6-CH ₃	\Box	с ₃ н ₇ -	н	(сн ₃)3с-снз	-

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp.	x	Y	z _n	A B	C*	R ¹	Fp °C
10	709	CH3	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	C2H ₅ -	
15	710	снз	снз	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-	Н	(сн ₃)2сн-	
	711	сн3	сн3	6-СН3	(CH ₃) ₂ CH-	н	(сн ₃) ₂ сн-сн	2-
20	712	снз	снз	6-CH ₃	(CH3)2CH-	н	сн ₃ с ₂ н ₅	
25	713	CH3	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	Н	(сн ₃) ₃ с-сн	2-
30	714	СНЗ	СНЗ	6-CH ₃	— н	н	СН3-	
35	715	сн3	сн3	6-CH3	— н	н	C ₂ H ₅ -	
	716	сн3	снз	6-CH3	— н	н	(CH ₃) ₂ CH-	•
40	717	сн3	снз	6-CH ₃	— н	н	(сн ₃)2сн-сн ₂	2-
45	718	CH3	снз	6-СН _З	н —	н	С ₂ Н ₅ СН-	

55

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5 .	Bsp. Nr.	x	Y	Z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	719	сн3	сн3	6-СН3	\bigcirc	Н	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
	720	сн3	снз	6-CH3	\bigcirc	н	н	\bigcirc	
15	721	СНЗ	- СН3	6-CH3	\bigcirc	н	н		
20	722	сн ₃	CH3	6-CH3	\bigcirc	сн ₃ -	н	сн ₃ -	
25 .	723	снз	сн3	6-CH ₃	\bigcirc	сн3-	н	С ₂ Н ₅ -	·
30	724	сн3	сн3	6-CH ₃	<u></u>	сн3-	н	(сн ₃) ₂ сн-	
	725	снз	снз	6-CH3	<u></u>	сн ₃ -	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
35	726	снз	снз	6-CH3	<u></u>	сн ₃ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
40	727	снз	снз	6-CH3	\bigcirc	СН ₃ -	н	(СН ₃) ₃ С-СН ₂ -	
_. 45	728	сн3	сн3	6-CH ₃		СН3-	н	\bigcirc	
;	729	СНЗ	сн3	6-CH3	<u></u>	СН ₃ -	н		

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

55

5	Bsp. Nr.	X	Y	Z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
10	730	CH3	сн3	6-CH ₃	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	Н	сн ₃ -	
	731	СН3	сн3	6-CH3	<u></u>	С ₂ Н ₅ -	н	с ₂ н ₅ -	
15	732	снз	сн3	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	Н	(сн ₃) 2сн-	
20	733	сн ₃	снз	6-CH3	<u></u>	с ₂ н ₅ -	н	(СН ₃) ₂ СН-СН ₂	:-
25	734	снз	сн3	6-CH3	\bigcirc	С ₂ Н ₅ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
30	735	сн3	снз	6-СН ^З	<u></u>	С ₂ Н ₅ -	н	(CH3)3C-CH	2-
	736	сн3	сн3	6-СН _З	<u></u>	с ₂ н ₅ -	н	\bigcirc	
35	737	CH3	СН3	6-СН _З		С ₂ Н ₅ -	н		
40	738	снз	СНЗ	6-CH ₃	· 🔷	С ₃ Н ₇ -	Н	С ₂ н ₅ -	
45	739	сн3	CH ₃	6-CH ₃	, <u> </u>	С ₃ н ₇ -	н	(СН3)2СН-	

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	740	сн3	СН3	6-CH ₃	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂	
15	741	сн ₃	сн3	6-CH3	\bigcirc	С ₃ Н ₇ -	н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
20	742	снз	сн ³	6-CH ₃	\bigcirc	С ₃ н ₇ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂	ı .
	743	снз	CH3	6-CH3		(сн ₃) ₂ сн-	н	с ₂ н ₅ -	
25	744	CH3	снз	6-CH3		(сн ₃) ₂ сн-	Н	(сн ₃) ₂ сн-	
30	745	CH3	снз	6-CH ₃		(сн ₃) ₂ сн-	н	(CH ₃) ₂ CH-CH	2
35	- 746	сн3	снз	6-СН _З	\bigcirc	(сн ₃) ₂ сн-	Н	C ₂ H ₅ CH-	
40	747	СН3	снз	6-CH ₃	\bigcirc	(сн ₃) ₂ сн-	н	(сн ₃) ₃ с-сн	2-
	748	CH3	снз	6-CH ₃	CH3-0-(CH	2)2- H	H	с ₂ н ₅ -	
	749	CH3	сн3	6-CH ₃	сн3-о- (сн	2)2- H	н	(CH ₃) ₂ CH-	
45	750	снз	CH3	6-CH3	сн3-о-(сн	2)2- H	н	(сн ₃) ₂ сн-сн	2
50	751	СНЗ	СНЗ	6-CH ₃	сн ₃ -о-(сн	1 ₂) ₂ - H	н	сн ₃ с ₂ н ₅	•

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	Z _n	λ	В	C ¹	R ¹	Fp °C
	752	CH ³	CH3	6-CH3	CH3-0-(CH2)2-	. н	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
10	753	СНЗ	CH3	6-CH3	сн3-0-(сн2)2-	сн3-	Н	C ₂ H ₅ -	
	754	снз	CH3	6-CH3	сн ₃ -о-(сн ₂) ₂ -	CH3-	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
15	755	сн3	CH3	6-CH3	сн3-о-(сн5)5-	ĊH3-	H	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	57
	756	снз	сн3	6-сн3	сн ₃ -о-(сн ₂) ₂ -	сн3-	н	сн ₃ сн-	54
20	757	сн3	сн3	6-CH3	сн ₃ -о-(сн ₂) ₂ -	сн3-	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	758	сн3	сн3	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)- H	Н	с ₂ н ₅ -	60
25	759	сн3	сн3	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)- H	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
23	760	CH3	сн3	6-CH3	сн3-о-сн5-сн(сн3)- H	Н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
30	761	снз	сн3	6-СН _З	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)- H	Н	СН ₃ СН- С ₂ Н ₅	·
	. 762	CH3	CH3	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)- H	H	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
35	763	CH3	СНЗ	6-CH3	сн3-о-сн5-сн(сн3)- CH ₃ -	H	C ₂ H ₅ -	
•••	764	CH3	CH3	6-CH3	сн3-о-сн5-сн(сн3)- CH3-	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
	765	CH3	CH3	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)- CH3-	H	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
40	766	снз	снз	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)- CH ₃ -	Н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
45	767	CH3	сн3	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)- CH ₃ -	H	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	

Herstellung der Zwischenprodukte

Beispiel I

55

11,25 g (0,15 Mol) Sarkosin und 3 g (0,075 Mol) NaOH werden in 210 ml Wasser gelöst. Unter Wasserbadkühlung werden 9 g (0,225 Mol) NaOH, gelöst in 45 ml Wasser, und 29,6 g (0,15 Mol Mesitylenessigsäurechlorid synchron zugetropft, wobei die Temperatur auf < 40°C gehalten wird. Nach 1 Stunde säuert man bei 0 bis 20°C mit konz. HCl, saugt ab und trocknet im Vakuum bei 70°C über P₂O₅. Es werden 37,1 g (99,3 % der Theorie N-(2,4.6-Trimethylphenyl-acetyl)-sarkosin vom Schmelzpunkt 140°C erhalten.

Beispiel II

5

15

20 H₃CH₃ CH₃ CH₃ CH₃

37,1 g (0,149 Mol) N-(2.4.6-Trimethylphenyl-acetyl)-sarkosin werden in 150 ml Methanol suspendiert, mit 22 ml (0,165 Mol) Dimethoxypropan versetzt und nach Zugabe von 1,43 g (7,5 mmol) p
Toluolsulfonsäure-monohydrat 3 Stunden unter Rückfluß erhitzt.

Nach Abdampfen des Lösungsmittels wird der Rückstand in CH₂Cl₂ aufgenommen, mit Bicarbonatlösung gewaschen, getrocknet und einrotiert. Man erhält 34 g (ca. 86,7% der Theorie) N-(2.4.6-Trimethylphenyl-acetyl)-sarkosin-methylester als hellgelbes ÖI.

¹H-NMR(200 MHz, CDCl₃):

 δ = 2,18, 2,2, 2,28 (s, 9H Ar-CH₃); 3,0, 3,2 (s, 3H, NCH₃), 3,64, 3,67 (s, 2H, CH₂-Ar), 3,66, 3,69 (s, 3H, OCH₃), 3,79, 4,14 (s, 2H, N-CH₂-CO), 6,82 (s, 2H, Ar 3-H, 5-H)

Beispiel III

40

45

50

17,4 g (0,12 Mol) N-Isopropylglycin-ethylester werden in 180 ml abs. THF gelöst und mit 16,8 ml (0,12 Mol) Triethylamin versetzt. Bei 0 - 10° C werden 26,82 g (0,12 Mol) 2.6-Dichlorphenylessigsäurechlorid in 20 ml abs. THF zugetropft. Nach 1 Stunde rührt man in 1 l Eiswasser + 100 ml 1 NHCl ein, extrahiert mit CH₂Cl₂, trocknet und engt ein. Es werden 36,8 g (89,1 % der Theorie) eines gelben Öls erhalten. ¹H-NMR(200 MHz, CDCl₃):

δ = 1,11 - 1,32 (m, 9H CH₂-CH₃ CH(CH₃)₂), 7,08 - 7,15 (1H, m, Ar 4-H), 7,25 - 7,32 (m, 2H, Ar-3-H, 5-H).
Die Wirkstoffe eignen sich zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, vorzugsweise Arthropoden und

Nematoden, insbesondere Insekten und Spinnentieren, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

- 5 Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.
 - Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus.
 - Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus carpophagus, Scutigera spec.
 - Aus der Ordnung der Symphyla z.B. Scutigerella immaculata.
 - Aus der Ordnung der Thysanura z.B. Lepisma saccharina.
- 10 Aus der Ordnung der Collembola z.B. Onychiurus armatus.
 - Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Leucophaea maderae, Blattella germanica, Acheta domesticus, Gryllotalpa spp., Locusta migratoria migratorioides, Melanoplus differentialis, Schistocerca gregaria.
 - Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. Forficula auricularia.
- 15 Aus der Ordnung der Isoptera z.B. Reticulitermes spp..
 - Aus der Ordnung der Anoplura z.B. Phylloxera vastatrix, Pemphigus spp., Pediculus humanus corporis, Haematopinus spp., Linognathus spp.
 - Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. Trichodectes spp., Damalinea spp.
 - Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. Hercinothrips femoralis, Thrips tabaci.
- 20 Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Eurygaster spp., Dysdercus intermedius, Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp.
 - Aus der Ordnung der Homoptera z.B. Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci, Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Brevicoryne brassicae, Cryptomyzus ribis, Aphis fabae, Doralis pomi, Eriosoma lanigerum, Hyalopterus arundinis, Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelis bilobatus, Nephotettix cincticeps, Lecanium comi, Saissetia oleae, Laodelphax striatellus,
- Nilaparvata lugens, Aonidiella aurantii, Aspidiotus hederae, Pseudococcus spp. Psylla spp.
 - Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Pectinophora gossypiella, Bupalus piniarius, Cheimatobia brumata, Lithocolletis blancardella, Hyponomeuta padella, Plutella maculipennis, Malacosoma neustria, Euproctis chrysorrhoea, Lymantria spp. Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Earias insulana, Heliothis spp., Spodoptera exigua, Mamestra brassicae, Panolis flammea, Prodenia litura, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella, Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella, Tineola bisselliella, Tinea pellionella, Hofmannophila pseudospretella, Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima,
- Tortrix viridana.

 Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. Anobium punctatum, Rhizopertha dominica, Acanthoscelides obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp.,
- Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica.
 - Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.
- Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa.
 - Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..
- Aus der Ordnung der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans.
 - Aus der Ordnung der Acarina z.B. Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp..
- Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp..
 - Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können weiterhin als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel

und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Charakteristisch für die erfindungsgemäßen Verbindungen ist, daß sie eine selektive Wirksamkeit gegen monokotyle Unkräuter im Vor- und Nachlaufverfahren (Pre- und Postemergence) bei guter Kulturflanzenverträglichkeit aufweisen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Dabei zeigen die erfindungsgemäßen Wirkstoffe neben einer hervorragenden Wirkung gegen Schadpflanzen gute Verträglichkeit gegenüber wichtigen Kulturpflanzen, wie z. B. Weisen, Baumwolle, Sojabohnen, Citrusfrüchten und Zuckerrüben, und können daher als selektive Unkrautbekämpfungsmittel eingesetzt werden.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe, Feinstverkapselungen in polymeren Stofen und in Hüllmassen für Saatgut, ferner in Formulierungen mit Brennsätzen, wie Räucherpatronen, -dosen, -spiralen u.ä., sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

25

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser; mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgas, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan. Propan. Stickstoff und Kohlendioxid: als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate; als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel; als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykol-Ether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von

Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Akariziden, Nematiziden Herbiziden oder Fungiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

Die erfindungsgemäß verwendbaren Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von Milben, Zecken usw. auf dem Gebiet der Tierhaltung und Viehzucht, wobei durch die Bekämpfung der Schädlinge bessere Ergebnisse, z.B. höhere Milchleistungen, höheres Gewicht, schöneres Tierfell, längere Lebensdauer usw. erreicht werden können.

Die Anwendung der erfindungsgemäß verwendbaren Wirkstoffe geschieht auf diesem Gebiet in bekannter Weise wie durch orale Anwendung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Granulaten, durch dermale bzw. äußerliche Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens (Dippen), Sprühens (Sprayen), Aufgießens (pour-on and spot-on) und des Einpuderns sowie durch parenterale Anwendung in Form beispielsweise der Injektion sowie ferner durch das "feed-through"-Verfahren. Daneben ist auch eine Anwendung als Formkörper (Halsband, Ohrmarke) möglich.

Beispiel A

30

Nephotettix-Test

Lösungsmittel: 7 Gewichtstelle Dimethylformamid Emulgator: 1 Gewichtstell Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Reiskeimlinge (oryza sativa) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven der Grünen Reiszikade (Nephotettix cincticeps) besetzt, solange die Keimlinge noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Zikaden abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Zikaden abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik: (5), (54), (55), (56), (57), (58).

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) weisen antimikrobielle, insbesondere starke antibakterielle und antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sproßpilze sowie biphasische Pilze, z.B. gegen Candida-Arten wie Candida albicans, Epidermophyton-Arten wie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Arten wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Arten wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Arten wie Microsporon felineum sowie Torulopsis-Arten wie Torulopsis glabrata. Die Aufzählung dieser Mikroorganismen stellt keinesfalls eine Beschränkung der bekämpfbaren Keime dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

Als Indikationsbeispiele in der Humanmedizin können beispielsweise genannt werden:

Dermatomykosen und Systemmykosen durch Trichophyton mentagrophytes und andere Trichophytonarten, Microsporonarten sowie Epidermophyton floccosum, Sproßpilze und biphasische Pilze sowie Schimmelpilze hervorgerufen.

Als Indikationsgebiet in der Tiermedizin können beispielsweise aufgeführt werden:

Alle Dermatomykosen und Systemmykosen, insbesondere solche, die durch die obengenannten Erreger hervorgerufen werden.

Zur vorliegenden Erfindung gehören pharmazeutische Zubereitungen, die neben nicht toxischen, inerten pharmazeutisch geeigneten Trägerstoffen einen oder mehrere erfindungsgemäße Wirkstoffe enthalten oder die aus einem oder mehreren erfindungsgemäßen Wirkstoffen bestehen.

Zur vorliegenden Erfindung gehören auch pharmazeutische Zubereitungen in Dosierungseinheiten. Dies bedeutet, daß die Zubereitungen in Form einzelner Teile, z.B. Tabletten, Dragees, Kapseln, Pillen, Suppositorien und Ampullenvorliegen, deren Wirkstoffgehalt einen Bruchteil oder einem Vielfachen einer Einzeldosis entspricht. Die Dosierungseinheiten können z.B. 1,2,3 oder 4 Einzeldosen oder 1/2, 1/3 oder 1/4 einer Einzeldosis enthalten. Eine Einzeldosis enthält vorzugsweise die Menge Wirkstoff, die bei einer Applikation verabreicht wird und die gewöhnlich einer ganzen, einer halben oder einem Drittel oder einem Viertel einer Tagesdosis entspricht.

Unter nicht toxischen, inerten pharmazeutisch geeigneten Trägerstoffen sind feste, halbfeste oder flüssige Verdünnungsmittel, Füllstoffe oder Formulierungshilfsmittel jeder Art zu verstehen.

Als bevorzugte pharmazeutische Zubereitungen seien Tabletten, Dragees, Kapseln, Pillen, Granulate, Suppositorien, Lösungen, Suspensionen und Emulsionen, Pasten, Salben, Gele, Cremes, Lotions, Puder oder Sprays genannt.

Tabletten, Dragees, Kapseln, Pillen und Granulate können den oder die Wirkstoffe neben den üblichen Trägerstoffen enthalten, wie (a) Füll- und Streckmittel, z.B. Stärken, Milchzucker, Rohrzucker, Glucose, Mannit und Kieselsäure re, (b) Bindemittel, z.B. Carboxymethylcellulose, Alginate, Gelantine, Polyvinylpyrrolidon, (c) Feuchthaltemittel, z.B. Glycerin, (d) Sprengmittel, z.B. Agar-Agar, Calciumcarbonat und Natriumbicarbonat, (e) Lösungsverzögerer, z.B. Paraffin und (f) Resorptionsbeschleuniger, z.B. quarternäre Ammoniumverbindungen, (g) Netzmittel, z.B. Cetylalkohol, Glycerinmonostearat, (h) Adsorptionsmittel, z.B. Kaolin und Bentonit und (i) Gleitmittel, z.B. Talkum, Calcium- und Magnesiumstearat und feste Polyethylenglykole oder Gemische der unter (a) bis (i) aufgeführten Stoffe.

Die Tabletten, Dragees, Kapseln, Pillen und Granulate können mit den üblichen gegebenenfalls Opakisierungsmittel enthaltenden Überzügen und Hüllen versehen sein und so zusammengesetzt sein, daß sie den oder die Wirkstoffe nur oder bevorzugt in einem bestimmten Teil des Intestinaltraktes, gegebenenfalls verzögert abgeben, wobei als Einbettungsmassen z.B. Polymersubstanzen und Wachse verwendet werden können.

Der oder die Wirkstoffe können gegebenenfalls mit einem oder mehreren der oben angegebenen Trägerstoffe auch in mikroverkapselter Form vorliegen.

Suppositorien können neben dem oder den Wirkstoffen die üblichen wasserlöslichen oder wasserunlöslichen Trägerstoffe enthalten, z.B. Polyethylenglykole, Fette, z.B. Kakaofett und höhere Ester (z.B. C₁₄35 Alkohol mit C₁₆-Fettsäure) oder Gemische dieser Stoffe.

Salben, Pasten, Cremes und Gele können neben dem oder den Wirkstoffen die üblichen Trägerstoffe enthalten, z.B. tierische und pflanzliche Fette, Wachse, Paraffine, Stärke, Tragant, Cellulosederivate, Polyethylenglykole, Silicone, Bentonite, Kieselsäure, Talkum und Zinkoxid oder Gemische dieser Stoffe.

Puder und Sprays können neben dem oder den Wirkstoffen die üblichen Trägerstoffe enthalten, z.B. Milchzucker, Talkum, Kieselsäure, Aluminiumhydroxid, Calciumsilikat und Polyamidpulver oder Gemische dieser Stoffe, Sprays können zusätzlich die üblichen Treibmittel z.B. Chlorfluorkohlenwasserstoffe enthalten.

Lösungen und Emulsionen können neben dem oder den Wirkstoffen die üblichen Trägerstoffe wie Lösungsmittel, Lösungsverzögerer und Emulgatoren, z.B. Wasser, Ethylalkohol, Isopropylalkohol, Ethylcarbonat, Ethylacetat, Benzylalkohol, Benzylbenzoat, Propylenglykol, 1,3-Buty lenglykol, Dimethylformamid, Öle, insbesondere Baumwollsaatöl, Erdnußöl, Maiskeimöl, Olivenöl, Ricinusöl und Sesamöl, Glycerin, Glycerinformal, Tetrahydrofurfurylalkohol, Polyethylenglykole und Fettsäureester des Sorbitans oder Gemische dieser Stoffe enthalten.

Zur parenteralen Applikation können die Lösungen und Emulsionen auch in steriler und blutisotonischer Form vorliegen.

Suspensionen können neben dem oder den Wirkstoffen die üblichen Trägerstoffe, wie flüssige Verdünnungsmittel, z.B. Wasser, Ethylalkohol, Propylalkohol, Suspendiermittel, z.B. ethoxylierte Isostearylalkohole, Polyoxyethylensorbit- und -sorbitanester, mikrokristalline Cellulose, Aluminiummetahydroxid, Bentonit, Agar-Agar und Tragant oder Gemische dieser Stoffe enthalten.

Die genannten Formulierungsformen können auch Färbemittel, Konservierungsstoffe sowie geruchsund geschmacksverbessernde Zusätze, z.B. Pfefferminzöl und Eukalyptusöl und Süßmittel, z.B. Saccharin enthalten.

Die therapeutisch wirksamen Verbindungen sollen in den oben angeführten pharmazeutischen Zubereitungen vorzugsweise in einer Konzentration von etwa 0,1 bis 99,5, vorzugsweise von 0,5 bis 95 Gew.-% der

Gesamtmischung vorhanden sein.

Die oben aufgeführten pharmazeutischen Zubereitungen können außer den erfindungsgemäßen Wirkstoffen auch weitere pharmazeutische Wirkstoffe enthalten.

Die Herstellung der oben aufgeführten pharmazeutischen Zubereitungen erfolgt in üblicher Weise nach bekannten Methoden, z.B. durch Mischen des oder der Wirkstoffe mit dem oder den Trägerstoffen.

Zur vorliegenden Erfindung gehört auch die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe, sowie von pharmazeutischen Zubereitungen, die einen oder mehrere erfindungsgemäße Wirkstoffe enthalten, in der Human- und Veterinärmedizin zur Verhütung, Besserung und/oder Heilung der oben aufgeführten Erkrankungen.

Die Wirkstoffe oder die pharmazeutischen Zubereitungen können tokal, oral, parenteral, intraperitoneal und/oder rektal, vorzugsweise parenteral, insbesondere intravenös appliziert werden.

Im allgemeinen hat es sich sowohl in der Human- als auch in der Veterinärmedizin als vorteilhaft erwiesen, den oder die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Gesamtmengen von etwa 2,5 bis etwa 200, vorzugsweise von 5 bis 150 mg/kg Körpergewicht je 24 Stunden, gegebenenfalls in Form mehrerer Einzelgaben zur Erzielung der gewünschten Ergebnisse zu verabreichen.

Bei oralen Applikationen werden die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Gesamtmengen von etwa 2,5 bis etwa 200, vorzugsweise von 5 bis 150 mg/kg Körpergewicht je 24 Stunden und bei parenteraler Applikation in Gesamtmengen von etwa 2,5 bis etwa 50, vorzugsweise von 1 bis 25 mg/kg Körpergewicht je 24 Stunden verabreicht.

Es kann jedoch erforderlich sein, von den genannten Dosierungen abzuweichenund zwar in Abhängigkeit von der Art und dem Körpergewicht des zu behandelnden Objektes, der Art und Schwere der Erkrankung, der Art der Zubereitung und der Applikation des Arzneimittels sowie dem Zeitraum bzw. Intervall, innerhalb welchem die Verabreichung erfolgt. So kann es in einigen Fällen ausreichend sein, mit weniger als der obengenannten Menge Wirkstoff auszukommen, während in anderen Fällen die oben angeführte Wirkstoffmenge überschritten werden muß. Die Festlegung der jeweils erforderlichen optimalen Dosierung und Applikationsart der Wirkstoffe kann durch jeden Fachmann aufgrund seines Fachwissens leicht erfolgen.

o Beispiel B

10

20

35

Antimykotische in-vitro-Wirksamkeit

Versuchsbeschreibung:

Die in-vitro-Prüfungen wurden mit Keiminokula von durchschnittlich 1 x 10⁴ Keimen/ml Substrat durchgeführt. Als Nährmedium diente Yeast Nitrogen Base-Medium für Hefen und Kimmig-Medium für Schimmelpilze und Dermatophyten.

Die Bebrütungstemperatur betrug 37 °C bei Hefen und 28 °C bei Schimmelpilzen und Dermatophyten, die Bebrütungsdauer lag bei 24 bis 96 Stunden bei Hefen und 96 bis 120 Stunden bei Dermatophyten und Schimmelpilzen.

Die Beurteilung der Fungizide erfolgt durch Ausplattieren und erneutes Bebrüten voll gehemmter Ansätze, wobei fungizide Konzentrationen weniger als 100 Keime c.f.n. (colony forming unit) pro ml enthalten.

In diesem Test zeigen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) gemäß den Herstellungsbeispielen 45, 46, 47 eine stark ausgeprägte antimykotische Wirksamkeit.

Ansprüche

1. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I)

$$\begin{array}{c|cccc}
C^* & R-O & X \\
\hline
A-N & O
\end{array}$$

in welcher

5

10

15

X für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff oder für die Gruppen -CO-R¹, -CO-O-R² steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl und Cycloalkyl, das durch Heteroatome unterbrochen sein kann, gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes tes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Arylalkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

2. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

X für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy steht,

30 Y für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl steht,

Z für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

-CO-R1 · (lb)

oder -CO-O-R² (lc)

steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl und Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann, steht.

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C₁-C₆-Alkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-, C₁-C₆-Halogenalkyl-, C₁-C₆-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl;

für gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-, C₁-C₆-Halogenalkyl-, C₁-C₆-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl-C₁-C₆-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,

45 für gegebenenfalls durch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Phenoxy-C1-C6-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen, Amino und C1-C6-Alkyl-substituiertes Hetaryloxy-C1-C6-Alkyl steht,

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C₁-C₆-Alkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-, C₁-C₆-Halogenalkyl-substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈- alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₂-C ₈-alkyl, Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl-C₁-C ₆-Haloalkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxyalkyl steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

- 3. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivat der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
- X für C₁-C₄-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy steht,
- Y für Wasserstoff, C1-C6-Alkyl, Halogen, C1-C4-Alkoxy, C1-C2-Halogenalkyl steht,
- Z für C₁-C₄-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy steht,
- 5 n für eine Zahl von 0-3 steht,
 - R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

-CO-R1 (lb)

oder -CO-O-R2 (lc)

steht, in welchen

10 R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl und Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff-und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl steht,

15 für gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl-C₁-C₄-alkyl steht,

für gegebenenfalls duch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,

gegebenenfalls für durch Halogen- und C1-C4-Alkyl-substituiertes Phenoxy-C1-C5-alkyl steht,

für gegebenfalls durch Halogen, Amino und C₁-C₄-Alkyl-substituiertes Hetaryloxy-C₁-C₅-alkyl steht,

6 R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₁₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl, steht,

für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro-, C₁-C₄-Alkyi, C₁-C₃-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff-und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann oder geebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Halogenalkyl-C₁-C₄-Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl-C₁-C₄-alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxyalkyl steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

- 4. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
- X für Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und Ethoxy steht,
- Y für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy und Trifluormethyl steht,
- Z für Methyl, Ethyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und Ethoxy steht,
- n für eine Zahl von 0-3 steht,
- R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

-CO-R1 (lb)

oder -CO-O-R² (Ic)

steht, in welcher

R¹ für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes: C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Polyalkoxyl-C₂-C₄-alkyl und Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff-und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl-, Trifluormethoxy-, Nitro- substituiertes Phenyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluor-methyl, Trifluormethoxy-substituiertes Phenyl-C₁-C₃-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Pyridyl, Pyrimidyl, Thiazolyl und Pyrazolyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Phenoxy-C1-C4-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Amino-, Methyl-, Ethyl-, substituiertes Pyridyloxy- C_1 - C_4 -alkyl, Pyrimidyloxy- C_1 - C_4 -alkyl und Thiazolyloxy- C_1 - C_4 -alkyl steht,

R² für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Polyalkoxy-C₂-C₅-alkyl steht

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Nitro-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, i-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluormethyl-substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff-und/oder Schwefelatomen unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, iso-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluormethyl-, Nitro susbtituiertes Aryl-C₁-C₃-alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxyalkyl steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel I.

5. Verfahren zur Herstellung von 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivaten der allgemeinen Formel (I)

 $\begin{array}{c|cccc}
C^* & R-O & X \\
\hline
A & N & O
\end{array}$

in welcher

10

15

20

25

40

50

X für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff oder für die Gruppen -CO-R¹, -CO-O-R² steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl und Cycloalkyl, das durch Heteroatome unterbrochen sein kann, gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl steht.

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Haloalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Arylalkyl steht,

B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy steht,

dadurch gekennzeichnet,

(A) daß man zum Erhalt der Verbindungen der Formel (Ia)

$$\begin{array}{c|cccc}
C^* & HO & X \\
\hline
A & N & O
\end{array}$$

N-Acylaminosäureester der Formel (II)

s in welcher

A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben und

R3 für Alkyl steht,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert, (B) oder, daß man zum Erhalt von Verbindungen der Formel (lb)

 $\begin{array}{c|c}
 & 0 \\
 & \parallel \\
 & R^{1}-C-O & X \\
\hline
 & C^{*} & Z_{n} \\
 & A & N & O
\end{array}$ (Ib)

Verbindungen der Formel (la),

15 B—-

$$\begin{array}{c|cccc}
C^* & HO & X \\
\hline
A & N & O
\end{array}$$
(Ia)

in welcher

5

10

20

A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben, entweder

²⁵ a)mit Säurehalogeniden der allgemeinen Formel (III)

Hal- C -R1 (III)

in welcher

R1 die oben angegebene Bedeutung hat

30 und

Hal für Halogen, insbesondere Chlor und Brom steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels,

oder

35 B) mit Carbonsäureanhydriden der allgemeinen Formel (IV)

R1-CO-O-CO-R1 (IV)

in welcher

R¹ die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels,

umsetzt,

45

50

(C) oder, daß man zum Erhalt von Verbindungen der Formel (Ic)

 $\begin{array}{c|c}
R^{2}O-C-O & X \\
\hline
C^{*} & & \\
A & N & O
\end{array}$ (1c)

in welcher

A, B, C, X, Y, Z, R² und n die oben angegebene Bedeutung haben, Verbindungen der Formel (la)

in welcher

5

30

35

40

45

50

A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben mit Chlorameisensäureester der allgemeinen Formel (V)

R²-O-CO-CI (V)

in welcher

R² die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfals in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

- 6. Insektizide und/oder akarizide und/oder herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivat der Formel (I).
- 7. Verfahren zur Bekämpfung von Insekten und/oder Spinnentieren und/oder Unkräutern, dadurch gekennzeichnet, daß man 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) auf Spinnentiere und/oder Unkräutern und/oder deren Lebensraum einwirken läßt.
- 8. Verwendung von 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivaten der Formel (I) zur Bekämpfung von Insekten und/oder Spinnentieren und/oder Unkräutern.
- Verfahren zur Herstellung von insektiziden und/oder akariziden und/oder herbiziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.
 - 10. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate gemäß Ansprüchen 1 bis 4 zur Bekämpfung von Mykosen.
 - 11. Antimykotische Mittel enthaltende 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate gemäß Ansprüchen 1 bis 4.
- 12. Verwendung von 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivaten gemäß Ansprüchen 1 bis 4 bei der Bekämpfung von Mykosen.
- 13. Verwendung von 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivaten gemäß Ansprüchen 1 bis 4 bei der Herstellung von Arzneimitteln zur Bekämpfung von Mykosen.

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 89123895.8

Anmeldetag: 23.12.89

(9) Int. Cl.5: **C07D** 207/38, C07D 405/12, A01N 43/36

Priorität: 07.01.89 DE 3900301 18.08.89 DE 3927222

Veröffentlichungstag der Anmeldung: 18.07.90 Patentblatt 90/29

Benannte Vertragsstaaten: BE CH DE ES FR GB IT LI NL

Be Veröffentlichungstag des später veröffentlichten Recherchenberichts: 24.04.91 Patentblatt 91/17

(7) Anmelder: BAYER AG

W-5090 Leverkusen 1 Bayerwerk(DE)

Erfinder: Fischer, Reiner, Dr. Nelly-Sachs-Strasse 23 W-4019 Monheim(DE) Erfinder: Baasner, Bernd, Dr. Wagner-Strasse 23

> W-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE) Erfinder: Hagemann, Hermann, Dr.

Kandinsky-Strasse 52 W-5090 Leverkusen 1(DE) Erfinder: Krebs, Andreas, Dr.

Im Gartenfeld 70

W-5068 Odenthal-Holz(DE) Erfinder: Marhold, Albrecht, Dr.

Carl-Duisberg-Strasse 329 W-5090 Leverkusen(DE)

Erfinder: Santel, Hans-Joachim, Dr.

Grünstrasse 9a

W-5090 Leverkusen(DE)

Erfinder: Schmidt, Robert R., Dr.

Im Waldwinkel 110

W-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE)

Erfinder: Lürssen, Klaus, Dr. August-Kierspel-Strasse 145 W-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE)

Erfinder: Becker, Benedikt, Dr.

Steinmannhof

I-39050 Pineta di Laives Bolzano(IT)

Erfinder: Schaller, Klaus, Dr. Am Sonnenschein 38 W-5600 Wuppertai 1(DE) Erfinder: Strang, Harry, Dr.

Heiderweg 53

W-4000 Düsseldorf 31(DE)

(54) 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate.

57 Es werden neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I)

$$\begin{array}{c|c}
C^* R-O & X \\
\hline
A-N & O
\end{array}$$

in welcher

X für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

Υ für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

für eine Zahl von 0-3 steht. n

für Wasserstoff oder für die Gruppen -CO-R1, -CO-O-R2

steht,

wobei R1 und R2 die im Anmeldungstext angegebene Bedeutung besitzen.

für gegebenenfalls durch Halogen substituier-Α tes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Arylalkyl steht,

unabhängig voneinander für Wasserstoff, B, C*

Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Die neuen Verbindungen besitzen eine überraschende insektizide, akarizide, herbizide und antimykotische Wirksamkeit.



EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung

EP 89 12 3895

Т	Vi-b des Delemen	E DOKUMENTE nts mit Angabe, soweit erforderlich,	Betrifft	KLASSIFIKATION DER
Kategorie	der maßgeblic	hen Telle	Anspruch	ANMELDUNG (Int. Cl.5)
X,D	EP-A-0 262 399 (TAI * Tabelle 7; Ansprü	KEDA) che 1,3 *	1	C 07 D 207/38 C 07 D 405/12
X,D	LIEBIGS ANN. CHEM., 1095-1098, VCH Verlaweinheim, DE; R. SCI "Cyclisierung von N-Acylglycinestern" * Insgesamt; bes. Sc. *	agsgesellschaft mbH, HMIERER et al.: -Acylalanin- und	1,5	A 01 N 43/36
				RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int. CI.5)
Der ve	nrijesende Recherchenhericht wurd	le für alle Patentansprüche erstellt	-	·
	Recherchenort	Abschlußdatum der Recherche	1	Profer
DF	EN HAAG	13-02-1991	KISS	SLER B.E.
X : von Y : von	KATEGORIE DER GENANNTEN E n besonderer Bedeutung allein betrach n besonderer Bedeutung in Verbindung deren Veröffentlichung derselben Kate hnologischer Hintergrund chtschriftliche Offenbarung	E: âlteres Pate pach dem A mit einer D: in der Anm gorie L: aus andern	ntdokument, das jedo smeldedatum veröffer eldung angeführtes D Gründen angeführtes	ntlicht worden ist okument Dokument